

ФАРМАКОЛОГИЯ

шпаргалки



Испытай сам,
передай 5 одноклассникам,
и будешь счастливым
и впереди сессии.

Шпаргалки

Валерия Малеванная

Фармакология

«Научная книга»

Малеванная В. Н.

Фармакология / В. Н. Малеванная — «Научная книга»,
— (Шпаргалки)

Информативные ответы на все вопросы курса «Фармакология» в соответствии с Государственным образовательным стандартом.

Содержание

1. Предмет фармакологии, ее история и задачи. Клиническая фармакология и виды фармакотерапии	6
2. Понятие о лекарствах. Рецепт, правила его оформления	7
3. Сроки действия рецептов и дозировка лекарственных веществ. Твердые лекарственные формы	8
4. Жидкие и мягкие лекарственные формы	10
5. Пути введения лекарственных веществ	11
6. Механизм действия лекарственных средств, дозы лекарственных веществ	12
7. Значение состояния организма и внешних условий для действия лекарств. Всасывание и распределение лекарственных веществ	13
8. Биотрансформация и выведение лекарственных веществ. Понятие о фармакогенетике	14
9. Классификация наркоза. Неингаляционный наркоз	15
10. Средства для ингаляционного и неингаляционного наркоза	16
11. Снотворные средства	18
12. Психотропные препараты. Нейролептики	19
13. Препараты группы нейролептиков	21
14. Галоперидол, дроперидол, хлорпротиксен, пропуперсин	22
15. Лепонекс, транквилизаторы, сибазон, ксанакс	24
16. Седативные средства (успокаивающие)	25
17. Антидепрессанты	26
18. Седативные средства растительного происхождения	27
19. Средства, стимулирующие ЦНС, кофеин, пирацетам	29
20. Аминалон, церебролизин, пиридигитол, кордиамин	30
21. Камфара, сульфокамфокаин, корень женьшеня, экстракт родиолы, пантокрин	31
22. Противосудорожные (противоэпилептические) средства	32
23. Средства для лечения паркинсонизма	33
24. Анальгезирующие средства, наркотические анальгетики	34
25. Антагонисты наркотических анальгетиков, ненаркотические анальгетики	36
26. Нестероидные противовоспалительные средства	37
27. Производные антраниловой кислоты	38
28. Рвотные и противорвотные препараты	39
29. Лекарственные средства, действующие преимущественно на периферические нейромедиаторные системы. М-холиномиметики	40
30. Антихолинэстеразные средства	42
31. М-холинолитики	43
32. Н-холинолитики	44
33. Курареподобные препараты	45
34. Адренергические средства	47
35. β -адреномиметики, α -и β -адреномиметики	48
36. Адреноблокаторы, α -адреноблокаторы	50
37. β -адреноблокаторы	51
38. Симпатолитики	52

39. Дофамин	53
40. Гистамин. Гистаминомиметики	54
41. Антигистаминные препараты	55
42. Гистодил, ранитидин, кетотифен	57
43. Супрастин, диазолин, кромолин-натрий	58
44. Серотонина адипинат	59
45. Местноанестезирующие средства	60
46. Вяжущие средства	61
47. Обволакивающие средства и адсорбирующие средства	63
48. Средства, содержащие эфирные масла. Горечи. Средства, содержащие аммиак	64
49. Средства, стимулирующие отхаркивание	66
50. Корень алтея, мукалтин, грудной эликсир, ликвиритон, глицирам	67
51. Классификация слабительных средств, листья сенны, рамнил, бисакодил	68
52. Классификация средств, действующих на сердечно-сосудистую систему	69
53. Классификация сердечных гликозидов. Гликозиды длительного действия	70
54. Гликозиды средней продолжительности действия	71
55. Гликозиды короткого и быстрого действия. Нестероидные и синтетические кардиотоники	72
56. Классификация антиаритмических препаратов	73

Валерия Николаевна Малеванная

Фармакология

1. Предмет фармакологии, ее история и задачи.

Клиническая фармакология и виды фармакотерапии

Фармакология – наука о действии лекарственных веществ на живые организмы и о путях изыскания новых лекарственных средств. Она является одной из самых древних наук. Известно, что в Древней Греции (III в. до н. э.) Гиппократ использовал различные лекарственные растения для лечения заболеваний. Во II в. н. э. римский врач Клавдий Гален широко применял в медицинской практике различные вытяжки из лекарственных растений. Известный врач средневековья Абу Али ибн Сина (Авиценна) в своих сочинениях упоминает большое количество лекарственных средств растительного происхождения (камфару, препараты белены, ревеня, спорыньи и др.). XV–XVI вв. – Парацельс применяет в лечебной практике уже неорганические лекарственные вещества: соединения железа, ртути, свинца, меди, мышьяка, серы, сурьмы. Постепенно развиваются экспериментальные методы исследования, благодаря которым стало возможным получение из растений чистых высококачественных веществ (папаверина, стрихнина и др.) и синтетических соединений.

В конце XVIII – начале XIX вв. появились первые руководства по лекарствоведению, написанные в России Н. М. Максимовичем-Амбодиком и А. П. Нелюбиным. Были открыты фармакологические лаборатории. К экспериментальной фармакологии определенный интерес проявляли клиницисты Н. И. Пирогов и А. М. Филомафитский. Они экспериментально изучали действие первых наркотических препаратов – эфира и хлороформа – на организм животных. Огромное значение для развития фармакологии имели исследования И. П. Павлова в области физиологии сердечно-сосудистой системы и его учение об условных рефлексах. Под его руководством и при непосредственном участии в клинике С. П. Боткина были исследованы многие лекарственные растения (горичвет, ландыш, строфант и др.).

И. П. Павловым была создана крупная школа отечественных фармакологов. После И. П. Павлова кафедру возглавил Н. П. Кравков, и оба они основоположники современной отечественной фармакологии.

Клиническая фармакология – изучает воздействие лекарственных средств на организм больного человека.

Фармакодинамика изучает совокупность эффектов лекарственного вещества и механизмов его действия.

Фармакокинетика – пути поступления, распределения, биотрансформации и выведения лекарств из организма человека.

Фармакотерапия – наука об использовании лекарственных веществ с лечебной целью. Выделяют следующие виды фармакотерапии: этиотропную, патогенетическую, симптоматическую, заместительную и профилактическую.

Этиотропная терапия направлена на устранение причины (этиологии) заболевания.

Патогенетическая направляет действие лекарств на устранение или подавление механизмов развития болезни.

Симптоматическая терапия устраняет или уменьшает отдельные симптомы заболевания.

Заместительная терапия применяется при недостаточности в организме больного биологически активных веществ – гормонов, ферментов и др.

Профилактическая терапия проводится для предупреждения заболеваний.

2. Понятие о лекарствах. Рецепт, правила его оформления

Лекарство – это вещество, применяемое с целью лечения какого-либо заболевания или для его профилактики.

Лекарственное вещество – это одно вещество или смесь веществ природного или синтетического происхождения.

Лекарственный препарат – это лекарственное средство в готовом для применения виде.

Лекарственная форма – это лекарственное вещество в наиболее удобной для приема больным форме.

Все лекарственные средства подразделяются на три группы:

- 1) список А (Venena – яды);
- 2) список Б (heroica – сильнодействующие);
- 3) лекарственные препараты, отпускаемые без рецепта врача.

Рецепт – это обращение врача к фармацевту об отпуске больному лекарств с указанием лекарственной формы, дозы и способа применения. Он является медицинским, юридическим и денежным документом в случае бесплатного или льготного отпуска лекарств.

Доза выражается в массовых или объемных единицах десятичной системы и обозначается арабскими цифрами. Число целых граммов отделяется запятой (1,0). Чаще используется: 0,1 – один дециграмм; 0,01 – один сантиграмм; 1,001 – один миллиграмм. Капли, входящие в состав лекарства, обозначаются римской цифрой, перед которой пишется gtts. Биологические единицы действия в рецепте указывают таким образом 500 000 ЕД. Жидкие вещества в рецептах указываются в мл (0,1 мл). Рецепт заверяется подписью и личной печатью. В рецепте в обязательном порядке указываются: возраст больного, дата выписки рецепта, фамилия и инициалы больного; фамилия и инициалы врача, порядок оплаты лекарства. Причем льготные рецепты выписываются на специальных бланках, имеющих штамп и печать.

На специальных бланках другого образца выписывают также средства из списка наркотических веществ, снотворные, анорексигенные средства.

Причем рецепт выписывает сам врач, ставит свою подпись и заверяет личной печатью. Кроме того, его подписывает главный врач или его заместитель, рецепт имеет круглую печать и штамп лечебного учреждения.

Такой же порядок прописывания определен и для препаратов-анаболиков, а также фенобарбитала, циклодола, эфедрина гидрохлорида, клофелина (глазных капель, ампул), мази сунореф. На других формах рецептурных бланков прописываются нейролептики, транквилизаторы, антидепрессанты, препараты, содержащие этиловый спирт и др.

Запрещается выписывать амбулаторным больным эфир для наркоза, хлорэтил, фентанил, сомбре-вин, кетамин. Рецепт начинается со слова Recipe (Rp. – сокращенно), что значит «возьми», затем перечисляются названия и количества выписываемых лекарственных веществ в родительном падеже. Сначала называется основное, затем вспомогательные.

Далее обозначают необходимую лекарственную форму. Например, *Misce ut fiat pulvis* (M. f. pulvis) – «смешай, чтобы получился порошок».

Для дозированных пишут: «*Da tales doses numero 10*» – «выдай таких доз числом 10». В конце рецепта после слова *Signa* (S) – «обозначь» на русском (или национальном) языке указывают способ употребления лекарства.

3. Сроки действия рецептов и дозировка лекарственных веществ. Твердые лекарственные формы

Рецепт на наркотические и ядовитые средства действителен 5 дней; на спирт этиловый – 10 дней; на все другие – до 2 месяцев со дня выписки.

К твердым лекарственным формам относятся таблетки, драже, порошки, капсулы, гранулы и др.

Таблетки (Tabulette, Tab.) получают методом прессования смеси лекарственного и вспомогательного вещества. Различают простые и сложные по составу.

1. Rp.: Tab. Analgini 0,5 № 10 D. S. По 1 таблетке 2–3 раза в день.

2. Rp.: Amidopyrini Butadioni aa 0,125 № 20 in tab.

S. По 1 таблетке 3 раза в сутки (после еды). Драже (Dragee) изготавливается путем наслаивания лекарственных и вспомогательных веществ на гранулы.

Rp.: Nitroxolini 0,05 D. t. d. № 50 in dragee

S. По 2 драже 4 раза в день во время еды.

Порошки (Pulveres, Pulv.) предназначены для внутреннего, наружного или инъекционного (после растворения) применения. Различают недозированные, простые и сложные по составу порошки, в том числе и присыпки, и дозированные, простые и сложные по составу порошки.

Масса дозированного порошка должна составлять 0,1–1,0. При дозе меньше 0,1 к составу добавляют индифферентные вещества, чаще всего сахар (Saccharum).

Летучие, гигроскопические дозированные порошки отпускают в специальной бумаге (вощенной, парафинированной или пергаментной) и в рецепте указывают: D. t. d. № 20 in charta (paraffinata, pergaminata).

1. Rp.: Streptocidi 10,0 D.

S. Для присыпки ран.

2. Rp.: Pul. foliorum Digitalis 0,05

D. t. d. № 30

S. По 1 порошок 2 раза в день.

Капсулы (Capsulae) – желатиновые оболочки, в которые включены дозированные порошкообразные, гранулированные, пастообразные, полужидкие и жидкие лекарственные вещества.

Rp.: Olei Ricini 1,0

D. t. d. № 30 in capsules gelatinosis

S. 1 капсуле на прием.

Гранулы (Granulae) – твердая лекарственная форма в виде частиц размером 0,2–0,3 мм, предназначенная для приема внутрь.

В состав гранул входят как лекарственные, так и вспомогательные вещества.

Rp.: Granulum urodani 100,0

S. По 1 ч. л. 4 раза в день (перед едой, в 0,5 стакана воды).

Кроме того, бывают пленки и пластинки (Mem-branulae et Lamellae) – специальные твердые лекарственные формы, в которых на полимерной основе содержатся лекарственные вещества; глоссетты (Glos-setes) – небольшие таблетки, предназначенные для сублингвального или защечного применения; карамели (Caramela) готовят в виде конфет с содержанием сахара и патоки.

Применяются для лечения заболеваний полости рта припарки (Cataplasmata) – полутвердые препараты, оказывающие противовоспалительное и антисептическое действие.

Растворимые таблетки (Solvellenaе) растворяют в воде. Раствор применяют наружно (например, таблетки фурацилина).

4. Жидкие и мягкие лекарственные формы

Растворы (Solutiones, Sol.) получают методом растворения лекарственных веществ в растворителе.

Концентрацию в сокращенном варианте выражают в процентах или в виде соотношения массы и объема. Различают водные и спиртовые растворы.

Галеновые препараты – это извлечения из растительного сырья, полученные с помощью нагревания или растворения соответствующих экстрактов. В качестве растворителя используют воду или спирт.

Настои (Infusa, Inf.) и отвары (Decocta, Dec.) являются водными извлечениями из сухих частей лекарственных растений.

Настойки (Tincturae, Ф-гае) и экстракты (Extracta, Extr.) – спиртовые (спиртоводные или спиртоэфир-ные) вытяжки из лекарственного сырья без нагревания.

Экстракты (Extractum, Extr.). Различают жидкие, густые и сухие экстракты.

Новогаленовые препараты получают в результате специальной обработки с высокой степенью очистки лекарственных препаратов (Adonisidum).

Дисперсные системы есть системы, где дисперсионной средой является жидкость (вода, масло, газ и др.), а дисперсной фазой – нерастворимые мелкие частицы. Это суспензии, аэрозоли, микстуры.

К жидким лекарственным формам относятся также аппликации, бальзамы, коллодии, кремы, лимонады, сиропы.

Аппликации (Applicationes) – жидкие или мази-подобные препараты, применяемые для нанесения на кожу с лечебной целью.

Бальзамы (Balsama) – жидкости, получаемые из растений и обладающие ароматическим запахом, антисептическими и дезодорирующими свойствами.

Коллодии (Collodia) – растворы нитроцеллюлозы в спирте с эфиром (1: 6), содержащие лекарственные вещества. Применяются наружно.

Кремы (Cremores) – полужидкие препараты, содержащие лекарственные средства, масла, жиры и другие вещества, но менее вязкие, чем мази.

Лимонады (Limonata) – жидкости сладкого вкуса или подкисленные для приема внутрь.

Сиропы (Sirupi) – густоватые, прозрачные, сладкие жидкости для приема внутрь.

Лекарственные формы для инъекций включают стерильные водные и масляные растворы. Различают простые и сложные по составу.

К мягким лекарственным формам относятся мази, пасты, линименты, свечи, пластыри. В качестве формообразующих основ используют жиры и жироподобные вещества, получаемые из нефти, синтетические полимеры.

Мази (Unguenta, Ung.) – мягкая лекарственная форма вязкой консистенции, применяемая для наружного применения и содержащая менее 25 % сухих (порошковых) веществ.

Пасты (Pastae, Past.) содержат не менее 25 % сухих веществ.

Линименты (Linimentum, Lin.) – жидкие мази, в которых растворенные вещества равномерно распределены в жидкой мазевой основе. Перед употреблением его взбалтывают. Свечи (суппозитории, Suppositoria, Supp.) – лекарственная форма твердая при комнатной температуре, но расплавляющаяся при температуре тела. Пластыри (Emplastra) – лекарственная форма в виде пластической массы, которая при температуре тела размягчается и прилипает к коже.

5. Пути введения лекарственных веществ

Различают энтеральный и парентеральный путь введения лекарственных веществ. Энтеральный путь – введение препарата внутрь через рот (*per os*), или *пе-рорально*; под язык (*sub lingua*), или *сублингвально*; в прямую кишку (*per rectum*), или *ректально*.

Прием препарата через рот. Достоинства: удобство применения; сравнительная безопасность, отсутствие осложнений, присущих парентеральному введению.

Недостатки: медленное развитие терапевтического действия, наличие индивидуальных различий в скорости и полноте всасывания, влияние пищи и других препаратов на всасывание, разрушение в просвете желудка и кишечника (инсулина, окситоцина) или при прохождении через печень.

Применение под язык (*сублингвально*). Лекарство попадает в большой круг кровообращения, минуя желудочно-кишечный тракт и печень, начиная действовать через короткое время.

Введение в прямую кишку (*ректально*). Создается более высокая концентрация лекарственных веществ, чем при *пероральном* введении.

Вводят свечи (*суппозитории*) и жидкости с помощью клизм. Недостатки этого способа: колебания в скорости и полноте всасывания препаратов, свойственные каждому индивидууму, неудобства применения, психологические затруднения.

Парентеральный путь – это различные виды инъекций; ингаляции; электрофорез; поверхностное нанесение препаратов на кожу и слизистые оболочки.

Внутривенное введение (*в/в*). Вводят лекарственные средства в форме водных растворов.

Достоинства: быстрое поступление в кровь, при возникновении побочного эффекта есть возможность быстро прекратить действие; возможность применения веществ, разрушающихся, невсасывающихся из ЖКТ. Недостатки: при длительном внутривенном способе введения по ходу вены могут возникнуть боль и сосудистый тромбоз, опасность инфицирования вирусами гепатита В и иммунодефицита человека.

Внутриартериальное введение (*в/а*). Используется в случаях заболевания некоторых органов (печени, сосудов конечности), создавая высокую концентрацию препарата только в соответствующем органе.

Внутримышечное введение (*в/м*). Вводят водные масляные растворы и суспензии лекарственных веществ. Лечебный эффект наступает в течение 10–30 мин. Объем вводимого вещества не должен превышать 10 мл.

Подкожное введение. Вводят водные и масляные растворы. Нельзя вводить подкожно растворы раздражающих веществ, которые могут вызвать некроз тканей.

Ингаляция. Вводят таким путем газы (летучие анестетики), порошки (кромогликат натрия), аэрозоли.

Инtrateкальное введение. Лекарство вводится непосредственно в субарахноидальное пространство. Применение: спинно-мозговая анестезия или необходимость создать высокую концентрацию вещества непосредственно в ЦНС.

6. Механизм действия лекарственных средств, дозы лекарственных веществ

В основе действия большинства лекарственных средств лежит процесс воздействия на физиологические системы организма, выражающиеся изменением скорости протекания естественных процессов. Возможны следующие механизмы действия лекарственных веществ.

Физические и физико-химические механизмы.

Речь идет об изменении проницаемости и других качеств клеточных оболочек вследствие растворения в них лекарственного вещества или адсорбции его на поверхности клетки; об изменении коллоидного состояния белков и т. п.

Химические механизмы. Лекарственное вещество вступает в химическую реакцию с составными частями тканей или жидкостями организма, при этом они воздействуют на специфические рецепторы, ферменты, мембраны клеток или прямо взаимодействуют с веществами клеток.

Действие на специфические рецепторы основано прежде всего на том, что макромолекулярные структуры избирательно чувствительны к определенным химическим соединениям. Лекарственные средства, повышающие функциональную активность рецепторов, называются агонистами, а препараты, препятствующие действию специфических агонистов, – антагонистами. Различают антагонизм конкурентный и неконкурентный. В первом случае лекарственное вещество конкурирует с естественным медиатором за места соединения в специфических рецепторах. Блокада рецептора, вызванная конкурентным антагонистом, может быть восстановлена большими дозами агониста или естественного медиатора.

Влияние на активность ферментов связано с тем, что некоторые лекарственные вещества способны повышать и угнетать активность специфических ферментов.

Физико-химическое действие на мембраны клеток (нервной и мышечной) связано с потоком ионов, определяющих трансмембранный электрический потенциал. Некоторые лекарственные препараты способны изменять транспорт ионов (антиаритмические, противосудорожные препараты, средства для общего наркоза).

Прямое химическое взаимодействие лекарств

возможно с небольшими молекулами или ионами внутри клеток. Принцип прямого химического взаимодействия составляет основу антидотной терапии при отравлении химическими веществами.

Различают пороговые, терапевтические и токсические дозы. Для каждого вещества имеется минимально действующая, или пороговая, доза, ниже которой действие не проявляется. Дозы выше пороговой могут быть использованы для лечебных целей, если они не вызывают явлений отравления. Такие дозы называются терапевтическими. Дозы, вызывающие отравление, называются токсическими; приводящие к смертельному исходу – летальными (от лат. *letum* – «смерть»). Широтой терапевтического действия называют диапазон между пороговой и минимальной токсической дозой. Чем больше широта терапевтического действия препарата, тем меньше опасность возникновения токсических явлений в процессе лечения.

Средние терапевтические дозы – это дозы, применяемые в медицинской практике и дающие хороший терапевтический эффект.

7. Значение состояния организма и внешних условий для действия лекарств. Всасывание и распределение лекарственных веществ

Идиосинкразия – чрезвычайно высокая чувствительность к лекарственным препаратам. Она может быть врожденной или результатом сенсibilизации, т. е. развития резкого повышения чувствительности к препарату в результате его применения. Имеются большие различия в действии лекарственных препаратов в зависимости от возраста (взрослых и детей), пола (так, женщины более чувствительны к лекарствам, нежели мужчины, особенно во время менструального периода и беременности). Большое значение имеет конституция человека. Упитанные и спокойные люди переносят большие дозы препарата лучше, чем худощавые и возбудимые. Существенное значение имеет диета. Натощак инсулин действует сильнее, чем после еды. При недостатке в пище витамина С сердечные гликозиды действуют значительно сильнее; белковое голодание резко изменяет реактивность организма на лекарственные вещества. Внешние условия также оказывают существенное влияние на действие лекарственных веществ. Так, дезинфицирующие вещества действуют на микробы значительно сильнее при температуре тела человека, чем при комнатной. Облучение организма изменяет его чувствительность к лекарственным препаратам.

Всасывание лекарственного вещества – это процесс поступления его из места введения в кровеносное русло, зависящий не только от путей введения, но и от растворимости лекарственного вещества в тканях, скорости кровотока в этих тканях и от места введения.

1. Пассивная диффузия. Таким путем проникают хорошо растворимые в липоидах лекарственные вещества, и скорость их всасывания определяется разностью его концентрации с внешней и внутренней стороны мембраны.

2. Активный транспорт. В этом случае перемещение веществ через мембраны происходит с помощью транспортных систем, содержащихся в самих мембранах.

3. Фильтрация. Лекарства проникают через поры, имеющиеся в мембранах, причем интенсивность фильтрации зависит от гидростатического и осмотического давления.

4. Пиноцитоз. Процесс транспорта осуществляется посредством образования из структур клеточных мембран специальных пузырьков, в которых заключены частицы лекарственного вещества, перемещающиеся к противоположной стороне мембраны и высвобождающие свое содержимое. Прохождение лекарственных средств через пищеварительный тракт тесно связано с их растворимостью в липидах и ионизацией. Установлено, что при приеме лекарственных веществ внутрь скорость их абсорбции в различных отделах ЖКТ неодинакова. Пройдя через слизистую оболочку желудка и кишечника, вещество поступает в печень, где под действием ферментов печени подвергается значительным изменениям. На процесс всасывания лекарства в желудке и кишечнике оказывает влияние рН. Так, в желудке рН 1–3, что способствует более легкому всасыванию кислот, а повышение в тонкой и толстой кишках рН до 8 – оснований.

8. Биотрансформация и выведение лекарственных веществ. Понятие о фармакогенетике

Биотрансформация – это комплекс физико-химических и биохимических превращений лекарственных средств, в процессе которых образуются метаболиты (водорастворимые вещества), легковыводящиеся из организма. Выделяют два типа метаболизма: несинтетический и синтетический. Несинтетические реакции метаболизма лекарств разделяют на катализируемые ферментами (микросомальные) и катализируемые ферментами другой локализации (немикросомальные).

Несинтетические реакции – это окисление, вое-становление и гидролиз. В основе синтетических реакций лежит конъюгация лекарственных препаратов с эндогенными субстратами (как то глицин, сульфаты, вода и др.). Все лекарственные вещества, принимаемые внутрь, проходят через печень, где происходит их дальнейшее превращение. На биотрансформацию влияют характер питания, заболевания печени, половые особенности, возраст и ряд других факторов, причем при поражении печени усиливается токсическое действие многих лекарственных веществ на центральную нервную систему и резко возрастает частота развития энцефалопатии. Выделяют микросомальную и немикросомальную биотрансформацию. Микросомальному преобразованию подвергаются легче всего жирорастворимые вещества. Немикросомальная биотрансформация происходит главным образом в печени. Различают несколько путей выведения (экскреции) лекарственных веществ и их метаболитов из организма. Основные – это выведение с калом и мочой, выдыхаемым воздухом, потовыми, слезными и молочными железами. С мочой выводятся путем клубочковой фильтрации и канальцевой секреции, при этом имеет значение их реабсорбция в канальцах почек. При почечной недостаточности клубочковая фильтрация снижается, что ведет к увеличению концентрации в крови различных препаратов, поэтому дозу препарата следует снизить. Из печени лекарственные вещества выходят в виде метаболитов или, не изменяясь, поступают в желчь и выводятся с калом. Под влиянием ферментов и бактериальной микрофлоры ЖКТ лекарственные препараты могут превращаться в другие соединения, вновь доставляемые в печень, где и проходит новый цикл.

Степень выведения лекарственных веществ следует учитывать при лечении больных, страдающих болезнями печени и воспалительными заболеваниями желчных путей. Клинические наблюдения показали, что эффективность и переносимость одних и тех же лекарственных средств у различных больных неодинакова. Изучением генетических основ чувствительности организма человека к лекарственным веществам и занимается фармакогенетика.

Наследственные факторы, определяющие необычные реакции на лекарственные средства, в основном являются биохимическими и проявляются чаще всего недостаточностью ферментов.

Биотрансформация лекарственных средств в организме человека происходит под влиянием специфических белков (ферментов).

Синтез ферментов находится под строгим генетическим контролем. При мутации соответствующих генов возникают наследственные нарушения структуры и свойств ферментов – ферментопатии.

9. Классификация наркоза. Неингаляционный наркоз

В зависимости от глубины различают четыре уровня хирургического наркоза.

Первый уровень – легкий наркоз: сознание и восприятие боли отсутствуют, но сильные болевые раздражения могут вызвать ответные двигательные и вегетативные реакции, мышечный тонус снижен, но не утрачен полностью. Этот уровень наркоза не пригоден для крупных хирургических операций, без применения дополнительных средств.

Второй уровень – выраженный наркоз: глоточный, гортанный, роговичный и конъюнктивальный рефлексы отсутствуют, глазные яблоки неподвижны, конъюнктива влажная, но слезотечения нет, зрачки сужены, реагируют на свет, рефлексы с брюшины сохранены, мышечный тонус резко снижен, дыхание ровное и глубокое, пульс и артериальное давление близки к норме. Этот наркоз можно использовать для большинства хирургических операций.

Третий уровень – глубокий наркоз: тонус скелетной мускулатуры отсутствует, дыхание приобретает брюшной тип, зрачки слегка расширены и постепенно перестают реагировать на свет, рефлексы с брюшины отсутствуют, роговица сухая, пульс частый, правильный, артериальное давление несколько снижено. На этом уровне наркоза можно проводить любые операции, но его поддержание требует большого опыта и внимания.

Четвертый уровень – передозировка: дыхание становится поверхностным, отмечаются судорожные сокращения диафрагмы, зрачки резко расширены, не реагируют на свет, кожа и слизистые оболочки синюшные, пульс учащен, нитевидный, артериальное давление резко падает.

Стадия бульбарного паралича. Дальнейшее углубление наркоза приводит к остановке дыхания. Деятельность сердца продолжается еще некоторое время после прекращения дыхания. Наконец, сердце останавливается, и наступает смерть. Средства для наркоза в зависимости от их физико-химических свойств и способов применения делят на ингаляционные и неингаляционные. К ингаляционным средствам относят летучие жидкости и газообразные вещества.

Неингаляционный наркоз наступает при введении наркотических веществ внутривенным путем, реже – внутримышечным и ректальным.

Неингаляционные по продолжительности действия подразделяются на средства короткого действия (про-панид, кетамин); средней продолжительности действия (тиопентал-натрий, предийон); длительного действия (натрия оксибутират).

Основной наркоз может быть однокомпонентным или многокомпонентным. Существует четыре способа использования ингаляционных средств для наркоза:

- 1) открытый способ с помощью маски Эсмарха;
- 2) полукрытый метод, сходный с открытым, но при нем не происходит смешивания с парами воздуха, наблюдается образование небольших количеств CO_2 ;
- 3) полукрытый метод. Наркотическая смесь, поступает в резервуар дозами по мере ее вдыхания и характеризуется накоплением в резервуаре CO_2 и повторным его вдыханием;
- 4) закрытый способ, требующий применения сложной аппаратуры, так как используется химическое вещество для нейтрализации CO_2 , присутствующего во вдыхаемом воздухе.

10. Средства для ингаляционного и неингаляционного наркоза

Эфир для наркоза (Aether pro narcosi, диэтиловый эфир).

Применение: для хирургического вмешательства, для длительного обезболивания. В настоящее время используется крайне редко.

Фторотан Phthorothanum (Halothanum, Narcotan).

Мощное наркотическое средство применяется при хирургических вмешательствах, диагностических исследованиях, в стоматологии.

Способ применения: в смеси с кислородом с помощью наркозных аппаратов (для вводного наркоза 3–4 об.% во вдыхаемой смеси, для поддержания хирургической стадии – 0,5–1,5 об.%).

Побочные действия: гипотермия, гипотония, бра-дикардия, фибрилляция желудочков, тошнота, рвота, головная боль.

Противопоказания: феохромоцитома, выраженный гипертиреоз, нарушения функции печени, гипотония, нарушения ритма сердца, I триместр беременности, применение во время родов.

Форма выпуска: во флаконах по 50 мл.

Азота закись (Nitrogenium oxydulatum).

Глубокого наркоза не вызывает.

Применение: обезболивание родов. Малые хирургические вмешательства. Способ применения: вдыхание азота закиси производится с помощью маски или интубации в смеси с кислородом (азота закиси 70–50 % и кислорода соответственно 30–50 %).

Побочные действия: незначительное отрицательное воздействие на дыхательную и сердечно-сосудистую системы, печень, почки. Редко – тошнота и рвота.

Противопоказания: заболевания нервной системы, хронический алкоголизм, острое алкогольное опьянение.

Форма выпуска: металлические баллоны емкостью 1,0 под давлением 50 атм. Хранение при комнатной температуре, вдали от огня.

Тиопентал-натрий (Thiopentalum-natrium).

Оказывает снотворное, а в больших дозах наркотическое действие.

Способ применения: вводится внутривенно в виде 2–2,5 %-ного раствора (детям, ослабленным больным – 1 %-ный раствор).

Побочные действия: ларингоспазм, гипотония, угнетение дыхания и сердечной деятельности.

Противопоказания: заболевания печени и почек, бронхиальная астма, гипотония, гиповолемия, лихорадочные состояния, воспалительные заболевания носоглотки.

Форма выпуска: во флаконах по 1 г, в упаковке № 10.

Калипсол (Calypsol). Обладает быстрым, резко выраженным, но не продолжительным действием.

Способ применения: вводят внутривенно, внутримышечно в индивидуальных дозах.

Побочные действия: повышение АД, учащение пульса, нарушение дыхания, галлюцинации, психомоторное возбуждение, нарушение сознания.

Противопоказания: эклампсия, артериальная гипертензия, нарушение мозгового кровообращения.

Форма выпуска: 5 %-ный раствор по 10 мл во флаконах.

Бриетал (Brietal).

Применение: вводный наркоз, наркоз при кратковременных хирургических вмешательствах, в диагностических целях.

11. Снотворные средства

Это вещества, способствующие наступлению сна, нормализации его глубины, фазности, длительности, предупреждающие ночные пробуждения. Различают следующие группы:

- 1) производные барбитуровой кислоты (фенобарбитал и др.);
- 2) препараты бензодиазепинового ряда (нитразепам и др.);
- 3) препараты пиридинового ряда (ивадал);
- 4) препараты пирролонового ряда (имован);
- 5) производные этаноламина (донормил).

Производные барбитуровой кислоты облегчают засыпание, резко меняют структуру сна: сокращают продолжительность и фазность быстрого сна. После пробуждения наблюдаются сонливость, разбитость, нарушение координаций движений.

Фенобарбитал (Phenobarbitalum) оказывает успокаивающее, снотворное и выраженное противосудорожное действие.

Применение: нарушение сна, эпилепсия, хорея, повышенная возбудимость нервной системы.

Способ применения: по 0,05—0,1 за 1 ч до сна.

Побочные действия: головная боль, атаксия, привыкание при длительном применении.

Противопоказания: заболевания печени и почек с нарушением функции.

Форма выпуска: порошок, таблетки № 6 по 0,05, по 0,1; по 0,005 – для детей. Список Б. Этаминал-натрия (Aethaminalum-natrium).

Снотворное средство.

Применение: нарушения сна.

Способ применения: внутрь 0,1–0,2 г, детям 0,01—0,1 г, per rectum 0,2–0,3, в/в 5—10 мл раствора. В. Р. Д – 0,3 г, В. С. Д. – 0,6 г.

Противопоказания: те же, что и у фенобарбитала.

Форма выпуска: порошок. Список Б.

Препараты бензодиазепинового ряда.

Нитрозепама (Nitrozeepamum), Neozepam, Eunocin, Radedorm и др.

Применение: нарушения сна различной этиологии, неврозы, психопатии с преобладанием тревоги и беспокойства.

Способ применения: разовая доза для взрослых 0,005—0,01 г, максимальная разовая доза – 0,02 г за 30 мин до сна. Курс лечения – 30–45 дней.

Побочные действия: сонливость, вялость, атаксия, нарушение координации движений, головная боль, редко – кожный зуд, тошнота.

Противопоказания: миастения, беременность, водителям транспорта, лицам, деятельность которых требует быстрой реакции.

Форма выпуска: таблетки по 0,005 г № 20 и по 0,01 № 10. Список Б.

Рогипнол (Rohypnol).

Активное вещество – флунитразепам. Укорачивает период засыпания, уменьшает число ночных пробуждений.

Применение: расстройства сна.

Способ применения: назначают внутрь по 0,5–1 мг непосредственно перед сном, больным с продолжительными расстройствами сна – 1–2 мг.

Побочные действия: повышенная утомляемость, головная боль, мышечная слабость, парестезии, выраженные нарушения функции печени, почек, беременность, лактация.

Форма выпуска: таблетки по 1 мг № 20; раствор для инъекций в 1 мл по 2 мг флунитрозепама.

12. Психотропные препараты. Нейролептики

Лекарственные средства, избирательно влияющие на сложные психические функции человека, регулирующие его эмоциональное состояние, мотивацию, поведение и психомоторную активность, относят к психотропным средствам. Классификация психотропных препаратов:

- 1) нейролептики;
- 2) анксиолитические седативные средства;
- 3) антидепрессанты;
- 4) психостимуляторы;
- 5) психодислептики.

С практической точки зрения делят препараты на следующие группы:

- 1) нейролептики;
- 2) транквилизаторы;
- 3) седативные средства;
- 4) антидепрессанты;
- 5) психостимуляторы.

Нейролептики (антипсихотические средства).

От седативных средств нейролептики отличаются наличием антипсихотической активности, способностью подавлять бред, галлюцинации, автоматизм и другие психопатологические синдромы и оказывать лечебное действие у больных шизофренией и другими психическими заболеваниями. Выраженным снотворным не обладают, но способствуют наступлению сна; усиливают действие снотворных и других успокаивающих средств; потенцируют действие наркотиков, анальгетиков, местных анестетиков и ослабляют эффекты психостимулирующих препаратов. Им свойственны противорвотный, гипотензивный, антигистаминный и другие эффекты.

Производные фенотиазина. Аминазин (Aminazinum).

Обладает выраженным седативным действием, а также противорвотным, антигистаминным, гипотензивным, усиливает действие снотворных, обезболивающих.

Применение: психические заболевания, сопровождающиеся психомоторным возбуждением принимают внутрь после еды по 0,025—0,05 1–3 раза в день. В/м вводят по 1–5 мл 2,5 %-ного раствора. В/в 2–3 мл (с 20 мл 40 %-ного раствора глюкозы) медленно при психомоторном возбуждении. Дозы для детей индивидуальны.

Побочные действия: гипотония, экстрапирамидные нарушения, аллергические реакции, диспептические явления, гепатит.

Противопоказания: заболевания печени и почек, гипотония, сердечно-сосудистая декомпенсация, нарушения функции желудка.

Форма выпуска: драже по 0,025 № 30; по 0,05 № 30; таблетки по 0,01 № 50 для детей; 2,5 %-ный раствор по 1 мл. Список Б.

Тизерцин (Tisercin).

Показания. Психомоторное возбуждение, психозы, шизофрения, депрессия и невротические реакции с чувством страха, тревоги, бессонница. Принимают внутрь по 0,025—0,4 г в сутки; в/м 2–4 мл 2,5 %-ного раствора; при необходимости – до 0,5–0,75 г.

Побочные действия: экстрапирамидные нарушения, сосудистая гипотония, головокружение, запор, сухость во рту, аллергические реакции.

Противопоказания: болезни печени, кроветворной системы; гипотония, декомпенсация сердечнососудистой системы.

Форма выпуска: драже по 0,025 г № 50; ампулы по 1 мл 2,5 %-ного раствора № 10. Список
Б.

13. Препараты группы нейролептиков

Этаперазин (Aethaperazinum, Perphenazini hydrochloridum).

Более активен, чем аминазин, по противорвотному действию и по способности успокаивать икоту.

Применение: неврозы, сопровождающиеся страхом, напряжением, неукротимая рвота и икота, рвота беременных, кожный зуд в дерматологии.

Способ применения: принимают внутрь в виде таблеток после еды. Для принимающих дозы – 0,004–0,01 1–2 раза в день. При возбуждении суточная доза может быть – 30–40 мг. Курс лечения – от 1 до 4 месяцев. Поддерживающая терапия 0,01–0,06 в сутки.

Побочное действие и противопоказания: такие же, как у аминазина.

Форма выпуска: таблетки, покрытые оболочкой, по 0,004; 0,006 и 0,01 № 50, № 100, № 250. Список Б.

Модитен, фторфеназин (Moditen, Phthorphenazine).

По строению близок к этаперазину и обладает сильным антипсихотическим действием, сочетающимся с некоторым активирующим эффектом.

Применение: разные формы шизофрении, депрессивно-ипохондрические состояния. Малые дозы при невротических состояниях, сопровождающихся страхом и напряжением.

Способ применения: принимают внутрь начиная с 0,001–0,002 г в день и постепенно повышая дозу до 10–30 мг в сутки (в 3–4 приема с интервалами 6–8 ч). Поддерживающая терапия – 1–5 мг в сутки; в/м вводят начиная с 1,25 мг (0,5 мл 0,25 %-ного раствора) до 10 мг в сутки.

Побочные действия: судорожные реакции, экстрапирамидные расстройства, аллергические явления.

Противопоказания: острые воспалительные заболевания печени, заболевания сердечно-сосудистой системы с выраженной декомпенсацией, острые заболевания крови, беременность.

Форма выпуска: таблетки по 1; 2,5 и 5 мг; ампулы по 1 мл 0,25 %-ного раствора. Список Б.

Модитен-депо, фторфеназин-деcanoат (Phthorphenazine decanoate). Сильный нейролептик, обладающий пролонгированным действием, препарат после однократной внутримышечной инъекции действует в зависимости от дозы до 1–2 недель и более.

Применение: такое же, что и у модитена, удобен для больных, которым затруднено назначение нейролептиков в обычной форме.

Способ применения и дозы: назначают в/м по 12,5–25 мг, а иногда 50 мг (0,5–2 мл 2,5 %-ного раствора) 1 раз в 1–3 недели.

Побочные действия: паркинсонизм, акатизия, тремор пальцев рук. Для предупреждения и купирования этих явлений принимают циклодол или другие противопаркинсонические препараты.

Стелазин (Stelazine). Активное нейролептическое средство.

Применение: шизофрения и другие психические заболевания, протекающие с бредом и галлюцинациями.

Способ применения: принимают внутрь по 0,005 с последующим повышением дозы в среднем на 0,005 в день (средняя терапевтическая доза 0,03–0,05 г в сутки); в/м вводят 1–2 мл 0,2 %-ного раствора.

Побочные действия: экстрапирамидные расстройства, вегетативные нарушения, в отдельных случаях токсический гепатит, агранулоцитоз и аллергические реакции.

14. Галоперидол, дроперидол, хлорпротиксен, пропульсин

Противопоказания: заболевания печени и почек, болезни сердца с нарушением проводимости и в стадии декомпенсации, беременность.

Форма выпуска: таблетки, покрытые оболочкой, по 0,005 и 0,01 г № 50; ампулы по 10 мл 0,2 %-ного раствора № 10; 0,5 %-ного раствора № 12.

Галоперидол (Haloperidol).

Нейролептик с выраженным антипсихотическим эффектом.

Применение: шизофрения, маниакальные, галлюцинаторные, бредовые состояния, острые и хронические психозы разной этиологии, в комплексной терапии.

Способ применения: принимают внутрь по 0,002—0,003 г в день, в/м и в/в вводят по 1 мл 0,5 %-ного раствора.

Побочные действия: экстрапирамидные расстройства. Сонливость.

Противопоказания: заболевания ЦНС, депрессия, нарушение сердечной проводимости, заболевания печени и почек.

Форма выпуска: таблетки по 0,0015 и по 0,005 г № 50; ампулы по 1 мл 0,5 %-ного раствора № 5; флаконы по 10 мл 0,02 %-ного раствора. Список Б.

Дроперидол (Droperidolum).

Этот нейролептик оказывает быстрое, сильное, но непродолжительное действие.

Применение: вводят внутривенно за 30–60 мин для премедикации и нейролептаналгезии (до операции) 2,05–10 мг (1–4 мл 0,25 %-ного раствора) вместе с 0,05—0,1 мг (12 мл 0,005 %-ного раствора фентанила или 20 мг (1–2 %-ного раствора) промедола.

Одновременно вводят 0,5 мг (0,5 мл 0,1 %-ного раствора) атропина. Применяют только в условиях стационара.

Побочные действия: возможно понижение артериального давления и угнетение дыхания.

Противопоказания: выраженный атеросклероз, нарушения проводимости сердечной мышцы, заболевания сердечно-сосудистой системы.

Форма выпуска: ампулы по 5 и 10 мл 0,25 %-ного раствора (12,5 или 25 мг; по 2,5 мг в 1 мл). Список А.

Хлорпротиксен (Chlorprothixen).

Оказывает антипсихотическое, антидепрессивное и седативное действие.

Применение: депрессии с тревожной симптоматикой, алкогольный делирий, нарушение сна, соматические заболевания с невротоподобными расстройствами, кожный зуд. Принимают внутрь по 0,025–0,05 г 3–4 раза в день, при необходимости – 0,6 г в сутки с постепенным снижением дозы.

Побочные действия: гипотония, сухость во рту, сонливость, тахикардия, нарушение зрения, головокружение, кожный зуд.

Противопоказания: отравление алкоголем и барбитуратами, эпилепсия, паркинсонизм, пожилой возраст, болезни сердца.

Форма выпуска: таблетки по 0,015 и 0,05 г № 50. Список Б.

Пропульпин (Prosulpin).

Блокирует допаминовые рецепторы головного мозга, вызывает антипсихотический эффект.

Применение: психозы, депрессия, невротические состояния, мигрень.

Способ применения: принимают внутрь 200–600 мг в сутки (в 2–3 приема). М. С. Д. – 2 г.

Побочные действия: головокружение, расстройства сна, психическое возбуждение, сухость во рту, запоры, рвота, гипертензия.

15. Лепонекс, транквилизаторы, сибазон, ксанакс

Обладает выраженным антипсихотическим и седативным действием.

Применение: шизофрения.

Способ применения: принимают внутрь в несколько приемов; средняя доза составляет 300 мг в сутки, максимальная – 600 мг в сутки, поддерживающая – 150–300 мг в сутки.

Побочные действия: сонливость, чувство усталости, головная боль, головокружение, тахикардия, гипотония, тошнота, рвота, запоры, нарушения мочеиспускания.

Противопоказания: агранулоцитоз, тяжелые заболевания печени и почек, коматозные состояния, токсические психозы, болезни сердца.

Форма выпуска: таблетки по 25 и 100 мг № 50; ампулы по 2 мл (по 50 мг в растворе для инъекций) № 50.

Транквилизаторы (анксиолитики)

Транквилизаторы (противосудорожные средства) – синтетические вещества, ослабляющие чувство страха, тревоги, внутреннего напряжения, но активизирующие при этом положительные эмоции.

Основные представители – производные бензо-диазепина, воздействующие на специфические рецепторы, локализующиеся в лимбической системе и гипоталамусе, применяющиеся в лечении невротических и пограничных состояний; нарушений сна; болезней сердечно-сосудистой системы.

Препараты бензодиазепинового ряда.

Сибазон (Sibazonum).

Синонимы: диазепам, седуксен; обладает выраженным транквилизирующим действием; относительно сильной противосудорожной активностью, антиаритмическим действием.

Применение: невротические и неврозоподобные состояния; нормализация сна; в комбинации с другими противосудорожными препаратами для лечения эпилепсии; синдром абстиненции при алкоголизме; предоперационная подготовка больных; зудящие дерматозы; как успокаивающее и снотворное больным язвенной болезнью.

Способ применения: назначают внутрь начиная с дозы 0,0025–0,005 г 1–2 раза в день. Разовая доза для взрослых от 0,005 до 0,015 г, для детей 0,002–0,005 г. Суточная доза не должна превышать 0,025 г в 2–3 приема.

Побочные действия: сонливость, тошнота, головокружение, нарушения менструального цикла, понижение либидо.

Противопоказания: острые заболевания печени и почек, тяжелая миастения, беременность; прием алкоголя.

Ксанакс (Xanax).

Активное вещество алпразолам. Уменьшает беспокойство, чувство тревоги, страха, напряжения.

Применение: состояние страха и тревоги; невротические и реактивные депрессии; депрессии, развившиеся на фоне соматических заболеваний. При состояниях тревоги принимают внутрь по 250 мкг 3 раза в сутки.

Средняя поддерживающая доза составляет 500 мкг (4 мг в сутки в несколько приемов); при депрессии – 500 мкг 3 раза в сутки; при необходимости – до 1–4 мг в сутки. Отмену препарата производить постепенно.

Побочные действия: сонливость, головокружение, задержка или недержание мочи, изменение массы тела. Форма выпуска: таблетки по 250 и 500 мкг, 1, 2, 3 мг № 30.

16. Седативные средства (успокаивающие)

Это природные и синтетические вещества, устраняющие повышенную возбудимость, раздражительность. Основной механизм действия – усиление процессов торможения или понижение процессов возбуждения, оказание регулирующего влияния на функции ЦНС. Они усиливают действие снотворных, анальгетиков и других нейротропных успокаивающих средств, облегчают наступление естественного сна и углубляют его. Применяют для лечения легкой степени неврозов, неврастений, начальной стадии гипертонической болезни, неврозов сердечно-сосудистой системы, спазмов ЖКТ. К седативным средствам относятся бромиды и препараты, полученные из растений.

Натрия бромид (*Natrii bromidum*).

Обладает способностью концентрировать и усиливать процессы торможения в коре головного мозга, восстанавливать равновесие между процессами возбуждения и торможения.

Применение: неврастения, истерия, повышенная раздражительность, бессонница, начальные формы гипертонической болезни, а также эпилепсия и хорей. Назначают внутрь до еды в растворах (микстурах). Доза для взрослых составляет от 0,1 до 1 г по 3–4 раза в день, в виде 3 %-ного раствора – по 1–2 ст. л. на ночь или 2–3 раза в день.

Побочные действия: бромизм, выражающийся в виде насморка, кашля, общей вялости, ослабления памяти, кожной сыпи и конъюнктивита. В этом случае большим количеством натрия хлорида (10–20 г в сутки) и воды (3–5 л в сутки) необходимо полоскать рот и часто мыть кожу, регулярно опорожнять кишечник.

Форма выпуска: порошок, из которого готовят растворы и микстуры.

Бромкамфара (*Bromcamphora*).

Показания, применение: такие же, как у натрия бромида, но также улучшает сердечную деятельность.

Форма выпуска: порошки и таблетки по 0,15 и 0,25.

Препараты, содержащие барбитураты Беллоид (*Belloid*).

Комбинированный препарат, оказывающий успокаивающее и адренолитическое действие.

Применение: расстройства вегетативной нервной системы, бессонница, повышенная раздражительность. Назначают внутрь по 1 драже 3–4 раза в сутки.

Побочные действия: тошнота, рвота, понос, сухость во рту.

Форма выпуска: драже в упаковке по 50 штук.

К этой группе относится и препарат беллатами-нал (*Bellataminalum*), который применяется также при нейродермитах и климактерических неврозах.

Противопоказания: беременность, глаукома.

К группе седативных относится и магния сульфат (*Magnesii sulfas*), выпускается в виде порошков и ампул; раствора 25 %-ного по 5 и 10 мл. При парентеральном применении оказывает успокаивающее действие на ЦНС. В зависимости от дозы наблюдается седативный, снотворный или наркотический эффект.

Применение: как успокаивающее, слабительное, противосудорожное, спазмолитическое, желчегонное, для лечения гипертонической болезни в начальной стадии и для купирования гипертонических кризов; для обезболивания родов. При отравлении магния сульфатом используют кальция хлорид.

17. Антидепрессанты

Противопоказания: миастения, повышенная чувствительность к компонентам препарата.

Это лекарственные вещества, устраняющие симптомы депрессии у нервно-психических и соматических больных. В большинстве случаев лекарственное взаимодействие происходит на уровне синаптической нейро-передачи. Подразделяются антидепрессанты на следующие группы: ингибиторы моноаминоксидазы, трициклические антидепрессанты, тетрациклические, селективные ингибиторы обратного захвата серотонина, комбинированные и переходные антидепрессанты и нормотимические средства.

Трициклические и тетрациклические антидепрессанты.

Имизин (Imizinum).

Синоним: Melipramin. Основной представитель этой группы. Тормозит обратный нейрональный захват моноаминов – нейромедиаторов.

Применение: депрессивные состояния различной этиологии, нейтрогенный энурез у детей. Назначают внутрь начиная с 0,075—0,1 г в день (после еды), постепенно повышая дозу до 0,2—0,25 г в день. Курс лечения – 4–6 недель. 0,025 г 1–4 раза в день – поддерживающая терапия. В условиях стационара при тяжелой депрессии вводят в/м по 2 мл 1,25 %-ного раствора, 1–3 раза в сутки. В. Р. Д. внутрь – 0,1, В. С. Д. – 0,3 г, в/м разовая – 0,05, суточная – 0,2 г.

Побочные действия: головные боли, потливость, головокружение, сердцебиение, сухость во рту, нарушение аккомодации, задержка мочеиспускания, бред, галлюцинации.

Противопоказания: ингибиторы моноаминоксидазы, препараты щитовидной железы, острые заболевания печени, почек, кроветворных органов, глаукома, расстройства мозгового кровообращения, инфекционные заболевания, аденома предстательной железы, атония мочевого пузыря. Требуется осторожного применения при эпилепсии, в I триместре беременности.

Форма выпуска: таблетки по 0,025 г и 1,25 %-ный раствор в ампулах по 2 мл. Список Б. Амитриптилин (Amitriptylinum).

По строению и действию близок к имизину.

Применение: такое же, как у имизина.

Побочные действия: такие же, но в отличие от имизина не вызывает бреда, галлюцинаций.

Форма выпуска: драже по 25 мг № 50; раствор для инъекций по 2 мл в ампулах № 10 (в 1 мл содержится 10 мг активного вещества).

Мапротилин (Maprotilinum).

Синоним: Ludiomil. Усиливает прессорное действие норадреналина, избирательно тормозит захват норадреналина пресинаптическими нервными окончаниями. Обладает умеренной транквилизирующей и холинолитической активностью.

Применение: депрессии различной этиологии; назначают внутрь по 25 мг 3 раза в день с постепенным увеличением дозы до 100–200 мг в сутки. При в/в капельном введении суточная доза – 25—150 мг.

Побочные действия: такие же, как и у имизина и амитриптилина.

Противопоказания: такие же, как и имизина и амитриптилина.

Форма выпуска: драже по 10, 25, 50 мг № 50, раствор для инъекций в ампулах по 2 мл № 10.

18. Седативные средства растительного происхождения

Корневище с корнями валерианы (*Rhizoma cum radicibus Valerianae*).

Препараты валерианы уменьшают возбудимость ЦНС, усиливают действие снотворных, обладают спазмолитическим действием.

Применение: повышенная нервная возбудимость, бессонница, кардионеврозы, спазмы ЖКТ. Назначают внутрь настой из 20 г корня на 200 мл воды по 1 ст. л. 3–4 раза в день; настойку на 70 %-ном спирте во флаконах по 20–30 капель 3–4 раза в день; экстракт густой в таблетках по 0,02—0,04 на прием.

Форма выпуска: корневище с корнями валерианы по 50 г в пачке; в брикетах по 75 г; настойка по 30 или 40 мл; густой экстракт в таблетках по 0,02 № 10 и № 50.

К этой группе относятся препараты из травы пустырника (*Herba Leonuri*), травы пассифлоры (*Herba Passiflorae*) и настойки пиона (*Tinctura Paeoniae*).

Применяются также фитопрепараты комбинированного действия.

Новопассит (*Novo-Passit*).

Комбинированный препарат, состоящий из комплекса экстрактов лекарственных растений и гвайфенецина.

Применение: легкие формы неврастения, расстройства сна, головные боли, обусловленные нервным перенапряжением. Принимают внутрь по 1 ч. л. (5 мл) 3 раза в сутки, можно до 10 мл в сутки.

Побочные действия: головокружение, вялость, сонливость, тошнота, рвота, диарея, кожный зуд, запор.

Противопоказания: миастения, повышенная чувствительность к компонентам препарата.

Форма выпуска: раствор по 100 мл во флаконе.

К этой группе относится и препарат фитосед по 100 мл.

Применение: такое же, как у новопассита.

Корвалол (*Corvalolum*) аналогичен импортному средству валокордину (*Valocardinum*), относится к группе комбинированных препаратов. В валокордин входит также масло хмеля, усиливающее действие.

Применение: неврозы, состояния возбуждения, функциональные расстройства сердечно-сосудистой системы. Назначают внутрь по 15–20 капель, при тахикардии и спазмах – до 40 капель.

Побочные действия: в отдельных случаях могут наблюдаться сонливость и легкое головокружение, при уменьшении дозы эти явления проходят.

Форма выпуска: корвалол по 15 мл; валокордин по 20 и 50 мл.

К этой же группе относится препарат валокор-мид (*Valocormidum*). Комбинированный препарат, в состав которого входит и натрия бромид.

Применение: такое же, как у корвалола.

Побочное действие и противопоказания: как у натрия бромида. Выпускается во флаконах по 30 мл.

Аурорикс (*Aurorix*).

Антидепрессант, обратимый ингибитор типа А.

Применение: депрессивные синдромы. Принимают внутрь по 150 мг 2 раза в сутки после еды, при необходимости – до 600 мг в сутки.

Побочные действия: головокружение, нарушения сна и другие, свойственные антидепрессантам.

Противопоказания: детский возраст, острые случаи спутанности сознания.
Форма выпуска: таблетки по 150 и 300 мг, покрытые оболочкой, № 30.

19. Средства, стимулирующие ЦНС, кофеин, пирацетам

Подразделяются на следующие группы.

1. Психостимуляторы, оказывающие стимулирующее влияние на функции головного мозга и активизирующие психическую и физическую деятельность организма и подразделяющиеся на две подгруппы.

К первой относятся кофеин, фенамин, сиднокарб и сиднофен, оказывающие быстро-наступающий стимулирующий эффект. У препаратов второй подгруппы действие развивается постепенно. Это ноотропические препараты: пирацетам, аминалон, натрия окси-бутират, фенибут, пантогам, энцефабол, ацефен.

2. Аналептические средства возбуждают в первую очередь центры продолговатого мозга – сосудистый и дыхательный; в больших дозах они стимулируют также моторные зоны головного мозга и вызывают судороги. Это коразол, кордиамин, камфара. Из группы analeptических средств выделяют группу дыхательных analeptиков (цититон, лобелин), для них характерно стимулирующее действие на дыхательный центр.

3. Средства, действующие преимущественно на спинной мозг. Основным представителем этой группы является стрихнин. Имеется еще одна группа разных растительных средств, оказывающих возбуждающее действие на ЦНС. Это плоды лимонника, корень женьшеня, пантокрин и др.

Психомоторные стимуляторы. Кофеин (Coffeinum).

Усиливает и регулирует процессы возбуждения в коре головного мозга, приводящие к повышению умственной и физической работоспособности.

Применение: отравление наркотическими средствами, недостаточность сердечно-сосудистой системы, спазмы сосудов головного мозга, повышение психической и физической работоспособности. Принимают внутрь, средняя доза кофеина для взрослых – по 0,05—0,1 г 2–3 раза в день. В. Р. Д. – 0,3; В. С. Д. – 1 г.

Побочные действия: при длительном применении происходит уменьшение действия, а при внезапном прекращении приема – усиление торможения явлениями утомления, сонливости, депрессии; снижение артериального давления.

Противопоказания: повышенная возбудимость, бессонница, выраженная гипертония, атеросклероз, органические заболевания сердечно-сосудистой системы, старческий возраст, глаукома. Форма выпуска: таблетки № 10. Кофеин-бензоат натрия (Coffeinum-natrii ben-zoas).

Аналогичен кофеину, но лучше растворяется в воде. Форма выпуска: таблетки по 0,1 и 0,2 № 5; в виде 10 и 20 %-ного раствора в ампулах по 1–2 мл. Пирацетам (Pyracetanum).

Синоним: (Nootropinum). Усиливает обменные процессы мозга, ускоряет передачу нервного импульса в мозге, улучшает микроциркуляцию, не оказывая при этом сосудорасширяющего действия.

Применение: хронические и острые нарушения мозгового кровообращения, черепно-мозговые травмы, депрессии различной этиологии, алкоголизм и наркомания. При тяжелых состояниях в/м или в/в вводят 2–6 г в сутки.

Побочные действия: повышенная раздражительность, возбудимость, нарушения сна, диспепсические явления.

Противопоказания: выраженные нарушения функции почек, беременность, лактация.

Форма выпуска: капсулы по 0,4 № 60; таблетки по 0,2 № 60, ампулы 20 %-ного раствора по 5 мл № 10.

20. Аминалон, церебролизин, пиридитол, кордиамин

Аминолон.

Синтетический аналог – ГАМК (g-аминомасляная кислота).

Применение: такое же, как у пирацетама, кроме того, применяется при укачивании.

Побочные действия: нарушение сна, ощущение жара, колебания артериального давления.

Форма выпуска: таблетки по 0,25 № 100.

Церебролизин (Cerebrolysinum).

Ноотропное средство. Это комплекс пептидов, полученных из головного мозга свиней.

Способствует улучшению обмена веществ в мозговой ткани.

Применение: заболевания ЦНС, травмы мозга, ослабление памяти, слабоумие. Вводят в/м по 1–2 мл через день. Курс лечения – 30–40 инъекций, при в/в введении – 10–60 мл.

Противопоказания: острая почечная недостаточность, эпилептический статус.

Форма выпуска: в ампулах по 1 мл № 10 и по 5 мл № 5.

Пиридитол (Pyriditolum).

Синоним: Encefabol; пикамилон, (Picamylon), ва-зобрал, (Vazobralum), инстенон, (Instenon), фенибут (Phenibutum), (билобил, (Bilobyl), танакан, (Tanacan). Танакан и билобил – препараты из растения гинго би-лоба.

Действие и применение: этих препаратов такое же, как у церебролизина.

Натрия оксибутират (Natrii oxybutyras).

По строению и действию близок к ГАМК, усиливает действие наркотических и анальгезирующих веществ.

Применение: как неингаляционное наркотическое средство для однокомпонентного наркоза, для вводного и базисного наркоза у лиц пожилого возраста, для уменьшения невротических реакций и улучшения сна.

Способ применения: в/в вводят из расчета 70–120 мг на 1 кг массы тела; ослабленным больным – 50–70 мг/кг. Растворяют в 20 мл 5%-ного (иногда 40 %-ного) раствора глюкозы. Вводят медленно (1–2 мл в минуту); в/м вводят в дозе 120–150 мг/кг или в дозе 100 мг/кг в сочетании с барбитуратами.

Побочные действия: при быстром в/в введении возможны двигательное возбуждение, судорожные подергивания конечностей и языка, иногда рвота, при передозировке – остановка дыхания.

Противопоказания: гипокалиемия, миастения, токсикозы беременности, неврозы, кома.

Форма выпуска: ампулы по 10 мл 20 %-ного раствора. Список Б.

Кордиамин (Cordiaminum).

Стимулирует ЦНС, возбуждает дыхательный и со-судодвигательный центры.

Применение: острые и хронические расстройства кровообращения, пониженный сосудистый тонус, ослабление дыхания, острый коллапс и асфиксия, шоковое состояние.

Способ применения: назначают внутрь до еды по 30–40 капель. Парентерально: п/к, в/м; в/в (медленно) вводят взрослым в дозе 1–2 мл 2–3 раза в день; детям – в зависимости от возраста. Для уменьшения болезненности предварительно в место инъекции вводят новокаин, В. Р. Д. – 2 мл (60 капель), В. С. Д. – 6 мл (180 капель); п/к разовая – 2 мл, суточная – 6 мл.

Форма выпуска: в ампулах по 1 мл и 2 мл для инъекций; во флаконе по 15 мл. Список Б.

21. Камфара, сульфокамфокаин, корень женьшеня, экстракт родиолы, пантокрин

Оказывает непосредственное действие на сердечную систему, усиливает обменные процессы в ней, повышает ее чувствительность к влиянию симпатических нервов, тонизирует дыхательный центр, стимулирует сосудодвигательный центр, улучшает микроциркуляцию.

Применение: острая и хроническая сердечная недостаточность, коллапс, угнетение дыхания, отравление снотворными и наркотическими средствами.

Побочные действия: возможно образование инфильтрата.

Противопоказания: эпилепсия, склонность к судорожным реакциям.

Форма выпуска: препараты для инъекций, используют 20 %-ный масляный раствор камфары; для наружного применения – масло камфарное (10 %-ный раствор камфары в подсолнечном масле) (Sol. Camphorae oleosae ad usum externum); мазь камфарную (Ung. Camphoratum) применяют при мышечных болях и ревматизме. Спирт камфарный (Spiritus Camphorae) во флаконах по 40 мл применяют для растираний.

Сульфокамфокаин (Sulfocamphocainum 10 % pro injectionibus).

Это комплексное соединение сульфакамфар-ной кислоты и новокаина. По действию оно близко к камфаре, но не вызывает образования инфильтратов. Применяют в основном при острой сердечной и дыхательной недостаточности, при кардиогенном шоке.

Форма выпуска: в ампулах по 2 мл 10 %-ный раствор № 10.

К этой группе еще относятся препараты цититон (Cytitonum) и лобелина гидрохлорид (Lobelinihydrochloridum). Применяют как дыхательные analeптики.

Назначают по 1 таблетке 5 раз в день с дальнейшим уменьшением дозы по 1–2 таблетке в день. Курс лечения – 20–25 дней. Список Б.

Разные средства, оказывающие возбуждающее влияние на ЦНС.

Корень женьшеня (Radix Ginseng).

Тонизирующее средство.

Применение: гипотония, усталость, переутомление, неврастения. Принимают по 15–20 капель 2 раза в день в первой половине дня.

Противопоказания: бессонница, повышенная раздражительность.

Форма выпуска: настойка на 70 %-ном спирте по 50 мл.

К этой группе также относятся: настойка лимонника (Tinctura Schizandrae), экстракт родиолы жидкой (Extractum Rhodiolae fluidum), настойка заманихи (Tinctura Echinopanacis), настойка аралии (Tinctura Araliae), экстракт элеутерококка (Extractum Eleuthero-cocci fluidum) и др.

Применение: как общеукрепляющее и тонизирующее средство, стимулятор ЦНС.

Экстракт родиолы розовой применяют также при явлениях астении, акинето-гипотоническом синдроме; вначале 10 капель 2–3 раза в день, затем до 30–40 капель. Курс лечения – 1–2 месяца.

Пантокрин (Pantocrinum).

Жидкий экстракт из рогов марала, изюбра и пятнистого оленя. Применяется как стимулятор ЦНС по 30–40 капель в день, п/к 1–2 раза в день. Курс лечения – 2–3 недели.

Противопоказания: выраженный атеросклероз, органические заболевания сердца, стенокардия, повышенная свертываемость крови, тяжелые формы нефрита, диарея. Список Б.

22. Противосудорожные (противоэпилептические) средства

Это лекарственные препараты, предупреждающие или прекращающие развитие судорог разного генеза и разной степени выраженности. В группу противосудорожных средств входят и противоэпилептические средства. Действие последних основано на подавлении возбудимости нейронов эпилептического очага или на торможении иррадиации патологической импульсации с эпилептогенного очага на другие отделы мозга. Противоэпилептические средства уменьшают частоту и силу припадков, замедляют процесс деградации психики. Наиболее распространенным средством является фенobarбитал.

Средства при больших судорожных припадках.

Фенобарбитал (Phenobarbitalum).

Назначается в субснотворных дозах. Это средство мы рассматривали ранее в группе снотворные средства.

Дифенин (Dipheninum).

Оказывает выраженное противосудорожное действие.

Применение: эпилепсия, в основном большие судорожные припадки. Назначают внутрь после еды по 0,1–0,3 г 1–3 раза в сутки.

Побочные действия: атаксия, тремор, дизартрия, нистагм, боль в глазах, раздражительность, кожные высыпания, желудочно-кишечные расстройства.

Противопоказания: болезни печени, почек, декомпенсация сердечно-сосудистой системы.

Форма выпуска: таблетки по 0,117 № 10.

Тегретол (Tegretol). Синонимы: Carbamazepinum, Finlepsin. Противоэпилептическое средство.

Применение: эпилепсия с большими судорожными припадками. Средняя доза в начале лечения – по 200 мг 1–2 раза в сутки, в дальнейшем – до 400 мг 2–3 раза в сутки.

Побочные действия: потеря аппетита, сухость во рту, тошнота, диарея, запор, сонливость, атаксия, нарушение зрения.

Противопоказания: повышенная чувствительность к препарату, атриовентрикулярная блокада сердца. Форма выпуска: таблетки по 200 и 400 мг № 30. К этой группе препарата также относятся гексамедин (Hexamedinum), бензонал (Benzonalum), хлоракон (Chloraconum), клоназепам (Clonazepamum). Синоним: Anteplepsin.

Средства при малых приступах эпилепсии. Суксилеп (Suxilep) – противосудорожное средство.

Применение: малые формы эпилепсии, миоклонические припадки. Принимают внутрь по 0,25 г 4–6 раз в сутки.

Побочные действия: диспепсия, головная боль, головокружение, лейкопения.

Форма выпуска: капсулы по 0,25 № 100.

Депакин (Depacine). Синонимы: вальпроевая кислота, вальпроат натрия (Acidum valpricum, Natrium val-proicum). Противосудорожный препарат.

Применение: малые эпилептические припадки. По 20–30 мг/кг в сутки; при необходимости – до 200 мг в сутки, через 3–4 дня. М. С. Д. – 50 мг/кг в сутки.

Побочные действия: тошнота, рвота, диарея, нарушение функции печени и поджелудочной железы, анемия, лейкопения, атаксия, тремор, аллергические реакции.

Форма выпуска: таблетки по 300 мг № 100.

23. Средства для лечения паркинсонизма

Препараты этой группы ослабляют или ликвидируют симптомы болезни Паркинсона и других заболеваний, связанных с преимущественным поражением подкорковых узлов головного мозга. Лечение этого заболевания основано на восстановлении нарушенного равновесия между дофаминергическими и холинергическими процессами в экстрапиримидной системе. По клиническому воздействию различают следующие средства:

- 1) препараты, влияющие на дофаминергические системы мозга;
- 2) противопаркинсонические холинолитические препараты;
- 3) средства для лечения спастичности.

Препараты, влияющие на дофаминергические системы мозга.

Леводопа (Levodopa).

Образуется в организме из аминокислоты тирозина, и является предшественником адренергических медиаторов дофамина, норадреналина и адреналина, устраняет или уменьшает акинезию и ригидность.

Применение: болезнь Паркинсона, паркинсонизм. Принимают внутрь после еды начиная с 0,25 г, увеличивая дозу до 4–6 г в 3–4 приема. В. С. Д. – 8 г. Во время лечения нельзя принимать витамин В6.

Побочные действия: тошнота, рвота, потеря аппетита, гипотония, аритмия, повышенная возбудимость, депрессия, тремор.

Противопоказания: нарушения функции печени и почек, детский возраст, лактация, болезни сердца, заболевания крови, узкоугольная глаукома, ингибиторы МАО. С осторожностью следует применять больным бронхиальной астмой, эмфиземой, с активной язвой желудка, при психозах и неврозах. Форма выпуска: капсулы и таблетки по 0,25 и 0,5 г № 100.

К этой же группе относится комбинированный препарат наком (Nacom), состоящий из 0,25 г леводопы и 25 мг карбидопы, у которого лечебное действие усилено, а побочные эффекты уменьшены.

Противопаркинсонические холинолитические препараты.

Циклодол (Cyclodolum).

Холиноблокатор с выраженными центральными (н-холинорецепторами) и периферическими (м-холинорецепторами) холиноблокирующими свойствами.

Применение: паркинсонизм различной этиологии. Внутрь по 0,001–0,002 г в сутки; возможно увеличение до 0,002–0,004 г в сутки. Побочные действия: сухость во рту, нарушения зрения, тахикардия, головокружение, психическое и двигательное возбуждение. Противопоказания: беременность, глаукома, аденома предстательной железы.

Форма выпуска: таблетки по 0,002 № 50. Список А.

Средства для лечения спастичности.

Мидокалм (Mydocalm). Подавляет полисинаптические спинномозговые рефлексy и понижает повышенный тонус скелетных мышц.

Применение: заболевания, сопровождающиеся повышенным мышечным тонусом, параличи, парезы, контрактуры, экстрапиримидные расстройства, в качестве вспомогательного средства в лечении паркинсонизма. Принимают внутрь по 0,05 г 3 раза в сутки с постепенным увеличением дозы до 0,45 г в сутки, вводят в/м – по 1 мл 10 %-ного раствора 2 раза в сутки, в/в – по 1 мл в сутки.

Побочные действия: головная боль, раздражительность, нарушение сна. Противопоказания: миастения, детский возраст (до 3 месяцев).

24. Анальгезирующие средства, наркотические анальгетики

Анальгезирующие средства – это лекарственные препараты, избирательно устраняющие болевую чувствительность или ослабляющие чувство боли. Анальгетики делят на две основные группы:

- 1) наркотические анальгетики;
- 2) ненаркотические анальгетики.

Наркотические анальгетики. Это препараты морфина и его синтетические заменители. Основной механизм действия: связь с опиатными рецепторами ЦНС и периферическими тканями, приводящая к стимуляции противоболевой системы и нарушению нейронной передачи болевых импульсов; оказание специфического влияния на ЦНС человека, выражающееся в развитии эйфории, а затем синдромов психической, физической зависимости и привыкания.

Морфина гидрохлорид (*Morphini hydrochloridum*).

Активный анальгетик.

Применение: боль различной этиологии. Принимают внутрь по 0,01—0,02 г, вводят п/к по 1 мл 1%-ного раствора. В. Р. Д. – 0,02, В. С. Д. – 0,05 г.

Побочные действия: тошнота, рвота, запор, угнетенное дыхание.

Противопоказания: дыхательная недостаточность, возможность развития наркомании.

Форма выпуска: ампулы по 1 мл 1%-ного раствора № 10. Список А.

Промедол (*Promedolum*).

Синтетический препарат, близкий к морфину, но меньше угнетает дыхательный центр и возбуждает центр блуждающего нерва, рвотный центр.

Применение: боль различной этиологии. Вводят п/к по 1 мл 1–2 %-ного раствора; принимают внутрь по 0,025—0,5 г. за прием.

Форма выпуска: порошки, таблетки по 0,025, ампулы и шприц-тюбики по 1 мл 1–2 %-ного раствора.

Омнопон (*Omnoponum*) – смесь алкалоидов опия, в том числе 50 %-ного морфина.

Действие, применение, побочное действие, противопоказания: такие же, как и у морфина.

Способ применения: вводят п/к по 1 мл 1–2 %-ного раствора, принимают внутрь – по 0,01—0,02 г.

Форма выпуска: ампулы по 1 мл 1–2 %-ного раствора № 10. Список Б.

Валорон (*Valoron*). Синоним: *Tilidinum*. Синтетический заменитель морфина центрального действия.

Применение: выраженный болевой синдром различного генеза. Принимают по 50—100 мг 4 раза в сутки. Суточная доза – 400 мг. Побочные действия: головокружение, тошнота, рвота, ослабление внимания, замедление реакции. Противопоказания: наркотическая зависимость, лактация.

Форма выпуска: капсулы по 50 мг № 10 и 20.

К этой группе относятся еще и следующие препараты: кодеин (*Codeinum*), кодеина фосфат (*Codeini Phosphas*) (оба препарата применяются для успокоения кашля), этилморфина гидрохлорид (*Aethylmorphini hydrochloridum*) – в основном в офтальмологии в виде глазных капель и мази.

Фентанил (*Phentanylum*). Оказывает сильное, быстрое, но короткое анальгезирующее действие.

Применение: для нейролептаналгезии в сочетании с нейролептиками; для снятия острых болей при инфаркте миокарда, стенокардии, почечных и печеночных коликах.

Вводят в/м или в/в 0,5–1 мл 0,005 %-ного раствора. При необходимости повторяют каждые 20–40 мин.

Побочные действия: возможно угнетение дыхания, устраняемое в/в введением налорфина, двигательное возбуждение, спазм, гипотония, синусовая тахикардия.

25. Антагонисты наркотических анальгетиков, ненаркотические анальгетики

Налорфина гидрохлорид (Nalorphini hydrochlori-dum).

Антагонист по отношению к морфину и другим опиатам, но сохраняет в определенной степени свойства морфина.

Применение: как антидот при резком угнетении дыхания и других нарушениях функций организма, вызванных острым отравлением при передозировке наркотических анальгетиков. Вводят в/в, в/м или п/к. Взрослым по 0,005—0,01 г (1–2 мл 0,5 %-ного раствора).

Побочные действия: при больших дозах возможны тошнота, сонливость, головная боль, психическое возбуждение. У наркоманов – приступ абстиненции.

Форма выпуска: порошок; 0,5 %-ный раствор в ампулах по 1 мл (для взрослых) и 0,05 %-ный раствор – для новорожденных.

Ненаркотические анальгетики – это препараты различного химического строения, обладающие обезболивающим, жаропонижающим и противовоспалительным действием. Механизм анальгезирующего эффекта: угнетение синтеза основных факторов воспалительной реакции (простагландинов, простациклинов и тромбоксана), нарушение проведения афферентных болевых импульсов к коре головного мозга.

Производные пирозолона.

Среди препаратов этой группы известны бутадиион (Butadinum), анальгин (Analginum), амидопирин (Amido-pyrimum), антипирин (Antipyrimum), кетазон (Cetazon) и тандедрил (Tandedril). Механизм действия: снижение энергообеспечения воспаления, угнетение активности протеолитических ферментов, уменьшение проницаемости капилляров и торможение воспалительной инфильтрации. Анальгин (Analginum).

Применение: боли различного происхождения, ревматизм, хорея. Принимают по 0,25—0,5 г 2–3 раза в день внутрь, при ревматизме – 0,5–1,0 г 3 раза в день. В/м вводят по 1–2 мл 50 %-ного раствора 2–3 раза в день.

Побочные действия: возможны аллергические реакции и анафилактический шок.

Форма выпуска: таблетки по 0,5 г № 10, порошок, ампулы по 1 и 2 мл 50 %-ного раствора. Анальгин входит в состав некоторых комбинированных препаратов: бе-нальгина (Benalginum), беллалгина (Bellalginum), тем-пальгина (Tempalginum), анапирина (Anapirinum), пенталгина (Pentalginum).

Бутадион (Butadionum).

Применение: как у анальгина. Принимают внутрь по 0,15 г 4–6 раз в сутки после еды. Мазь наносят тонким слоем, не втирая, на поверхность кожи 2–3 раза в сутки.

Побочные действия: тошнота, боль в области желудка, болезни печени и почек, аритмия, недостаточность кровообращения. Форма выпуска: таблетки по 0,05 г № 10; мазь – 20 г в тубе.

Производные парааминофенола.

К ним относятся препараты фенацетин (Phenacetinum) и парацетамол (Paracetamolum). Широко применяется парацетамол. Фенацетин в чистом виде практически не используется, а в смеси с другими средствами это – препараты седальгин, цитрамон.

Парацетамол (Paracetamolum). Синонимы: Acetaminophen, Panadolum, Efferalganum. Жаропонижающее и болеутоляющее. Применение: как у других препаратов, по 0,2–0,4 г на прием. Побочные действия: нефро-токсичен. Противопоказания: заболевания почек. Форма выпуска: таблетки по 0,2 г № 10.

26. Нестероидные противовоспалительные средства

Механизм действия: оказывают нормализующее влияние на повышенную проницаемость капилляров и на процессы микроциркуляции, таким образом уменьшая энергетическое обеспечение биохимических процессов играющих роль в воспалении. К этой группе относятся салициламид, ацетилсалициловая кислота (аспирин) – *Acidum acetylsalicylicum (Aspyrinum)*.

Фармакологическое действие и показания такие же, как у других анальгетиков, но еще обладает антиагрегатным действием, поэтому используется и для профилактики тромбозов и эмболий.

Применение: принимают по 0,5–1,0 3–4 раза в день после еды, для профилактики тромбозов – 125–300 мг в день.

Побочные действия: тошнота, снижение аппетита, боли в области желудка, анемия, ulcerogenicное действие.

Противопоказания: язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, болезни почек, склонность к кровотечениям, беременность.

Форма выпуска: таблетки по 100, 300 и 500 мг № 10 и 100. Комбинированные препараты с аспирином: Алка-прим, Алка-Зельтцер, аспирин Упса с витамином С, аскофен, цитрамон, седальгин.

Производные индолуксусной кислоты представлены препаратами: индометацином (метиндолом); то-лектином; клинорилом.

Индометацин (*Indometacinum*). Синоним: *Metin-dolum*. Блокирует синтез простагландинов и миграцию лейкоцитов в область воспаления.

Применение: ревматические болезни суставов, травмы опорно-двигательного аппарата, невралгии.

Принимают внутрь после еды по 25 г 2–3 раза в день. Мазь наносят на участки 2 раза в день. Побочные действия: головная боль, головокружение, диспепсические явления, анемия, боли в области желудка.

Противопоказания: язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, нарушение процессов кроветворения, лактация, беременность, возраст до 14 лет.

Форма выпуска: капсулы по 0,25 № 30; мазь 10 %-ная в тубах по 40 г; ректальные свечи по 50 и 100 мг № 10.

Производные фенилуксусной кислоты.

Диклофенак натрия (*Diclofenac natrium*). Оказывает сильное противовоспалительное, анальгезирующее и жаропонижающее действие, ингибирует агрегацию тромбоцитов.

Применение: ревматические заболевания и другие воспалительные и дегенеративные болезни суставов. Принимают внутрь по 25 мг 2–3 раза в день после еды, затем дозу увеличивают до 100–150 мг в день. В/м – не более 2 ампул в течение суток.

Побочное действие и противопоказания: как у индометацина. Форма выпуска: таблетки по 25 мг № 30 и 10; раствор для инъекций – 3 мл в ампулах № 5 (1 мл содержит 25 мг активного вещества).

Нестероидные препараты – производные пропионовой кислоты. К производным пропионовой кислоты относятся: ибупрофен (*Ibuprofenum*), кетопро-фен (*Cetoprofen*), фенпрофен (*Phenoprofen*), напро-ксен (*Naproxen*).

Ибупрофен (*Ibuprofenum*).

Фармакологическое действие, показания к применению, побочные действия и противопоказания: такие же, как и индометацина.

Форма выпуска: таблетки, покрытые оболочкой, по 0,2 № 100.

27. Производные антраниловой кислоты

Основные представители: флуфенамовая кислота (арлеор) и ее алюминиевая соль (опирин); мефенами-новая кислота (понстан, понстил); нифлумовая кислота (дональгин). Механизм действия: разобщение окислительного фосфолирования и угнетение активности лизосомных ферментов.

Дональгин (Donalgin).

Нестероидный противовоспалительный препарат. Активное вещество – нифлумовая кислота.

Применение: ревматизм, болезни опорно-двигательного аппарата, болевые синдромы при переломах, воспалительные заболевания лор-органов.

Способ применения: принимают внутрь после еды по 250 мг 3 раза в день, при необходимости дозу увеличивают до 1 г в день, поддерживающая доза 250–500 мг в день.

Побочное действие и противопоказания: такие же, как у индометацина.

Форма выпуска: капсулы по 250 мг № 30.

Кислота мефенамовая (Acidum mefenamicum).

По анальгезирующей активности она равноценна бутадйону и превосходит салицилаты, а по жаропонижающему действию равна этим препаратам.

Показания, побочное действие и противопоказания: свойственные препаратам этой группы.

Форма выпуска: таблетки по 0,25 и 0,5 г № 50.

Оксинамы и препараты с выраженным аналь-гетическим эффектом.

Оксинамы – это новый класс неспецифических противовоспалительных средств, обладающих выраженным противовоспалительным действием.

К ним относятся лорноксикам (ксефокам) (Lornoxcam) (Xenofocam), мелоксикам (Meloxcam) (мовалис) (Movalis), пироксикам (Piroxicam) (хотемин, толдин, эразон, роксикам, фелден), теноксикам (табитал, теноктил).

Пироксикам (Piroxicam).

Неспецифическое противовоспалительное средство с выраженным анальгезирующим действием, обладает также жаропонижающим свойством.

Применение, побочное действие и противопоказания: такие же, как у других нестероидных препаратов, кроме того, еще вызывает депрессию и сонливость.

Форма выпуска: капсулы по 10 и 20 мг № 20. Торадол (Toradol).

Синоним: Ketanov. По своим обезболивающим свойствам приближается к опиоидным препаратам.

Показания: кратковременное купирование сильных болей, требующих обезболивания, по интенсивности аналогично применению препаратов группы морфина и его заменителей.

Способ применения: принимают внутрь по 10 мг однократно, при необходимости – каждые 6 ч; в/м и в/в вводят в дозе 10–30 мг однократно. При многократном применении – не более 5 суток.

Побочные действия: боли в животе, диспепсия, нарушение зрения, головокружение, нарушение сна, бради-кардия, гипертония, изменения со стороны крови.

Противопоказания: язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки; беременность, состояния с высоким риском кровотечения.

Форма выпуска: таблетки по 10 мг № 10; ампулы (в 1 мл 30 мг) № 5.

28. Рвотные и противорвотные препараты

Рвота – чаще всего защитный акт, направленный на освобождение желудка от попавших в него раздражающих и токсических веществ.

Иногда рвота – это сопутствующий процесс, ухудшающий состояние организма и обусловленный различными факторами. Нередко рвота наступает в результате перевозбуждения лабиринтного аппарата. Контролируется она специальными структурами продолговатого мозга – рвотным центром и так называемой триггерной зоной.

Рвота развивается при возбуждении рвотного центра: при непосредственном воздействии на него токсических или лекарственных веществ; при рефлекторном возбуждении центростремительных путей, а также при поступлении в него импульсов от хеморе-цепторов пусковой зоны. Она особенно чувствительна к действию химических веществ.

И рвотное, так же как и противорвотное, действие многих лекарственных веществ, реализуется путем первичного возбуждения или торможения этой зоны. Рвотные средства – лекарственные препараты, вызывающие рвоту при их применении. Различают рвотные средства центрального действия (апоморфин, *Apomorphini hydrochloridum*) и рвотные средства периферического действия (сульфат меди, *Cuprumsulfatis*), сульфат цинка.

Апоморфин (*Apomorphini hydrochloridum*).

Рвотное средство центрального действия, стимулирующие хеморецепторы триггерной зоны.

Показания: как рвотное средство, при хроническом алкоголизме для выработки реакции отвращения к алкоголю.

Способ применения: вводят п/к по 0,2–0,5 мл 1%-ного раствора.

Побочные действия: сосудистый коллапс, тремор, судороги, угнетение дыхательного центра.

Противопоказания: тяжелые сердечно-сосудистые заболевания, болезни легких, язвенная болезнь.

Форма выпуска: ампулы 1 %-ного раствора по 1 мл № 10. Список А.

Противорвотные препараты. Лекарственные средства из разных фармакологических групп, действующие на рвотный центр, триггерную зону, а также оказывающие центральное и периферическое действие. К ним относятся м-холиноблокаторы, антигистаминные препараты, нейролептики группы фенотиазина и бути-рофенона и др.

Диметпрамид (*Dimetpramidum*). Противорвотное средство, блокирующее хеморецепторы триггерной зоны. Не обладает кумулятивным действием.

Показания: рвота различного генеза.

Побочные действия: снижение артериального давления, сонливость.

Противопоказания: заболевания печени и почек с нарушением функций, гипотония.

Форма выпуска: таблетки по 0,02 № 50.

Мотилиум (*Motilium*). Противорвотный препарат. Антагонист периферических и центральных дофаминовых рецепторов. Усиливает перистальтику желудка, ускоряет его опорожнение.

Применение: тошнота и рвота различного генеза. Принимают внутрь за 15–20 мин по 20 мг 3–4 раза в течение дня и перед сном.

Побочные действия: спазмы кишечника, повышение уровня пролактина в плазме крови.

Противопоказания: желудочно-кишечное кровотечение, непроходимость желудка или кишечника, перфорация желудка.

Форма выпуска: таблетки по 10 мг № 30 и 10.

29. Лекарственные средства, действующие преимущественно на периферические нейромедиаторные системы. М-холиномиметики

В периферической нервной системе различают афферентные нервы – чувствительные, несущие информацию в ЦНС, и эфферентные нервы – центробежные, по которым из ЦНС осуществляется координация деятельности внутренних органов. Средства, действующие на периферическую нервную систему, подразделяют на две группы: лекарственные средства, влияющие на эфферентную иннервацию, и лекарственные средства, влияющие на афферентную иннервацию. Холинергические синапсы проявляют разную чувствительность к лекарственным веществам: синапсы и рецепторы, расположенные в них и чувствительные к мускарину, называют мускариночувствительными, или м-холинорецепторами; к никотину – никотиночувствительными, или н-холинорецепторами. Холинергические средства подразделяются на следующие группы:

- 1) м-холиномиметики (ацеклидин, пилокарпин);
- 2) н-холиномиметики (никотин, цититон, лобелин);
- 3) м-н-холиномиметики прямого действия (ацетилхолин, карбахоллин);
- 4) м-н-холиномиметики непрямого действия, или анти-холинэстеразные средства;
- 5) м-холинолитики (атропин, скополамин, платифиллин, метацин);
- 6) н-холинолитики:
 - а) ганглиоблокирующие средства (гигроний, бензо-гексоний, пирилен);
 - б) курареподобные средства (тубокурарин, дитилин);
- 7) м-р-холинолитики (циклодол).

М-холиномиметики. При введении этих веществ наблюдаются эффекты возбуждения парасимпатической нервной системы, брадикардия, снижение артериального давления (кратковременная гипотензия), бронхоспазм, усиление перистальтики кишечника, потоотделения, слюноотечения, сужение зрачка (миоз), уменьшение внутриглазного давления, спазм аккомодации.

Ацеклидин (Aceclidinum). Активное м-холиномиметическое средство с сильным миотическим действием.

Показания: послеоперационная атония ЖКТ и мочевого пузыря, в офтальмологии – для сужения зрачка и понижения внутриглазного давления при глаукоме.

Способ применения: вводят п/к 1–2 мл 0,2 %-ного раствора. В. Р. Д. – 0,004 г, В. С. Д. – 0,012. В офтальмологии применяют 3–5 %-ную глазную мазь.

Побочные действия: слюноотечение, потливость, понос.

Противопоказания: стенокардия, атеросклероз, бронхиальная астма, эпилепсия, гиперкинезы, беременность, желудочные кровотечения.

Форма выпуска: ампулы по 1 мл 0,2 %-ного раствора № 10, мазь 3–5 %-ная в тубах по 20 г.

Пилокарпина гидрохлорид (Pilocarpini hydro-chloridum). Понижает внутриглазное давление при глаукоме. Стимулирует периферические м-холинореактивные системы.

Показания: открытоугольная глаукома, атрофии зрительного нерва, непроходимость сосудов сетчатки.

Способ применения: вводят в конъюнктивальный мешок по 1–2 капли 1 %-ного раствора 3 раза в день, при необходимости – 2 %-ный раствор.

Побочные действия: стойкий спазм цилиарной мышцы.

Противопоказания: ирит, иридоциклит, другие заболевания глаз, где нежелателен миоз.

Форма выпуска: глазные капли 1–2 %-ные во флаконах по 1, 5, 10 мл, в тубик-капельнице по 1,5 мл № 2.

30. Антихолинэстеразные средства

Различают антихолинэстеразные средства обратимого действия (физостигмин, прозерин, оксазил, галантамин, калимин, убретид) и необратимого действия (фосфакол, армин), причем вторые более токсичные.

Прозерин (Prozerinum).

Обладает выраженной антихолинэстеразной активностью.

Показания: миастения, парезы, параличи, глаукома, атония кишечника, желудка, мочевого пузыря, как антагонист миорелаксантов.

Способ применения: принимают внутрь по 0,015 г 2–3 раза в день; вводят п/к по 1 мл 0,05 %-ного раствора (1–2 мл раствора в день), в офтальмологии – по 1–2 капли 0,5 %-ного раствора 1–4 раза в день.

Побочные действия: брадикардия, гипотония, слабость, гиперсаливация, бронхорея, тошнота, рвота, повышение тонуса скелетной мускулатуры.

Противопоказания: эпилепсия, бронхиальная астма, органические заболевания сердца.

Форма выпуска: таблетки по 0,015 г № 20, ампулы по 1 мл 0,05 %-ного раствора № 10.

Калимин (Kalymin).

Менее активен, чем прозерин, но действует более продолжительно.

Применение: миастения, нарушения двигательной активности после травмы, паралича, энцефалит, полиомиелит.

Способ применения: назначают внутрь по 0,06 г 1–3 раза в день, вводят в/м – по 1–2 мл 0,5 %-ного раствора.

Побочные действия: гиперсаливация, миоз, диспептические явления, учащение мочеиспускания, повышение тонуса скелетных мышц.

Противопоказания: эпилепсия, гиперкинезы, бронхиальная астма, органические заболевания сердца.

Форма выпуска: драже по 0,06 г № 100, 0,5 %-ный раствор в ампулах по 1 мл № 10.

Убретид (Ubretid).

Антихолинэстеразный препарат длительного действия.

Применение: атония и паралитическая непроходимость кишечника, мочевого пузыря, атонические запоры, периферический паралич скелетной мускулатуры.

Побочные действия: тошнота, диарея, боли в животе, саливация, брадикардия.

Противопоказания: гипертонус органов ЖКТ и мочевыводящих путей, энтерит, язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, заболевания сердечно-сосудистой системы, бронхиальная астма.

Форма выпуска: таблетки по 5 мг № 5, раствор для инъекций в ампулах (в 1 мл содержится 1 мг убретиды) № 5.

Армин (Arminum).

Активный антихолинэстеразный препарат необратимого действия.

Применение: миотическое и антиглаукомное средство.

Способ применения: назначают 0,01 %-ный раствор по 1–2 капли в глаз 2–3 раза в день.

Побочные действия: боль в глазу, гиперемия слизистой оболочки глаза, головные боли.

31. М-холинолитики

Препараты этой группы блокируют передачу возбуждения в м-холинорецепторах, делая их нечувствительными к медиатору ацетилхолину, в результате чего возникают эффекты, противоположные действию парасимпатической иннервации и м-холиномиметиков.

М-холиноблокаторы (препараты группы атропина) подавляют сек-рецию слюнных, потовых, бронхиальных, желудочных и кишечных желез. Выделение желудочного сока уменьшается, но продукция соляной кислоты, секреция желчи и ферментов поджелудочной железы снижаются незначительно. Они расширяют бронхи, снижают тонус и перистальтику кишечника, расслабляют желчевы-водящие пути, снижают тонус и вызывают расслабление мочеточников, особенно при их спазме. При действии м-холиноблокаторов на сердечно-сосудистую систему возникают тахикардия, усиление сердечных сокращений, увеличение минутного объема сердца, улучшение проводимости и автоматизма, незначительное повышение артериального давления. При внесении в полость конъюнктивы вызывают расширение зрачка (мидриаз), повышение внутриглазного давления, паралич аккомодации и сухость роговицы. По химическому строению м-холи-ноблокаторы подразделяются на третичные и четвертичные аммониевые соединения. Четвертичные амины (матацин, хлорозил, пропантелин бромид, фубромеган, ипратропиум бромид, тровентол) плохо проникают через гематоэнцефалический барьер и проявляют только периферическое холинолитическое действие.

Атропина сульфат (Atropini sulfas).

Обладает м-холинолитической активностью. Блокирует м-холинореактивные системы организма.

Применение: язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, спазмы сосудов внутренних органов, бронхиальная астма, в офтальмологии – для расширения зрачка.

Способ применения: назначают внутрь по 0,00025—0,001 г 2–3 раза в день, п/к по 0,25—1 мл 0,1 %-ного раствора, в офтальмологии – 1–2 капли 1 %-ного раствора. В. Р. Д. – 0,001, В. С. Д. – 0,003.

Побочные действия: сухость во рту, тахикардия, нарушение зрения, атония кишечника, затруднение мочеиспускания.

Противопоказания: глаукома.

Форма выпуска: ампулы по 1 мл 0,1 %-ного раствора № 10, глазные капли (1 %-ный раствор) по 5 мл, порошок. Список А.

Метацин (Methacinum).

Синтетический м-холинолитик, по активности превосходит атропин.

Применение, побочные действия, противопоказания: те же, что и у атропина.

Способ применения: назначают внутрь по 0,002–0,004 г 2–3 раза в день, парентерально по 0,5–2 мл 0,1 %-ного раствора.

Форма выпуска: таблетки по 0,002 № 10, ампулы по 1 мл 0,1 %-ного раствора № 10. Комбинированные препараты, содержащие м-холинолитики: беллатами-нал, белласпон, беллоид, бесалол, беллалгин. Назначают по 1 таблетке 2–3 раза в день при спазмах кишечника, повышенной кислотности желудочного сока и других; свечи (бетиол и анузол) применяют при геморрое и трещинах прямой кишки.

32. Н-холинолитики

Группа лекарственных средств, избирательно блокирующая н-холинорецепторы вегетативных ганглиев, синокаротидной зоны и мозгового слоя надпочечников, называется ганглиоблокаторами, а группа, блокирующая н-холинорецепторы нервно-мышечных синапсов, – миорелаксантами, или курареподобными средствами.

Ганглиоблокирующие средства, блокируя н-холинорецепторы вегетативных ганглиев вызывают ряд характерных изменений:

1) расширяют сосуды и снижают артериальное давление, снижают выделение адреналина, уменьшают импульсацию насосодвигательный центр с каротидного клубочка, расширяют сосуды нижних конечностей и улучшают их кровообращение. Ганглиоблокаторы короткого действия используют при отеке легких и мозга, а также для управляемой гипотонии во время операций с целью уменьшения кровопотери;

2) снижают тонус гладких мышц внутренних органов и уменьшают секрецию желез;

3) оказывают стимулирующее действие на мускулатуру матки, например пахикарпин.

Ганглиоблокаторы короткого действия. Гигроний (Hygronium).

Применение: в анестезиологии для создания искусственной гипотонии. Вводят в/в (капельно) 0,01 %-ный раствор в изотоническом растворе хлорида натрия или 5 %-ном растворе глюкозы.

Побочные действия: резкая гипотония.

Форма выпуска: порошок по 0,1 г в ампуле емкостью 10 мл № 10. Список Б.

Ганглиоблокаторы продолжительного действия.

Бензогексоний (Benzohezonium). Применение: спазм периферических сосудов, гипертоническая болезнь, гипертонические кризы, бронхиальная астма, язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки. Назначают внутрь по 0,1–0,2 г 2–3 раза в день, п/к, в/м – 1–1,5 мл 2,5 %-ного раствора. В. Р. Д. – внутрь 0,3 г; В. С. Д. – 0,9 г; п/к разовая – 0,075 г, суточная – 0,3 г.

Побочные действия: общая слабость, головокружение, сердцебиение, ортостатический коллапс, сухость во рту, атония мочевого пузыря.

Противопоказания: гипотония, тяжелые поражения печени и почек, тромбофлебиты, тяжелые изменения ЦНС.

Форма выпуска: таблетки по 0,1 г № 20, ампулы по 1 мл 2,5 %-ного раствора № 10.

Пентамин (Pentaminum).

Показания к применению, побочные эффекты и противопоказания: аналогичны бензогексонию.

Форма выпуска: в ампулах по 1 и 2 мл 5%-ного раствора.

Пахикарпина гидройодид (Pachycarpini hydroiodidum).

Применение: при спазмах периферических сосудов и для стимуляции родов, для уменьшения кровотечений в послеродовом периоде. Назначают внутрь, п/к, в/м.

Противопоказания: беременность, резкая гипотензия, болезни печени и почек.

Форма выпуска: выпускается в таблетках по 0,1 г, ампулах по 2 мл 3%-ного раствора. Отпускается только по рецепту врача. Список Б. К этой же группе относятся таблетки пирилена (Pirilenum) и темехин (Temechinum) по 0,005 г.

33. Курареподобные препараты

Курареподобные средства вещества блокируют н-холинорецепторы скелетных мышц и вызывают расслабление скелетной мускулатуры (миорелаксанты). По механизму действия их разделяют на вещества:

1) антидеполяризующего (конкурентного) типа действия (тубокурарин, диплацин, меликтин);

2) деполяризующего типа действия (дитилин);

3) смешанного типа действия (диоксоний).

По продолжительности действия миорелаксанты подразделяются на три группы:

1) короткого действия (5—10 мин) – дитилин;

2) средней продолжительности (20—40 мин) – тубоку-рарин-хлорид, диплацин;

3) длительного действия (60 мин и более) – анатрук-соний.

Тубокурарин-хлорид (*Tubocurarine-chloridum*).

Это курареподобный препарат с антидеполяризующим действием.

Применение: в анестезиологии для расслабления мускулатуры. Вводят в/в по 0,4–0,5 мг/кг. При операции доза – до 45 мг.

Побочные действия: возможна остановка дыхания. Для ослабления действия препарата вводят про-зерин.

Противопоказания: миастения, выраженные нарушения почек и печени, старческий возраст.

Форма выпуска: в ампулах по 1,5 мл, содержащих 15 мг препарата № 25.

Дитилин (*Dithylinum*), листенон (*Lysthenon*).

Синтетические деполяризующие миорелаксанты короткого действия.

Применение: интубация трахеи, оперативные вмешательства, вправление вывихов. Вводится в/в из расчета 1–1,7 мг/кг массы тела больного.

Побочные действия: возможно угнетение дыхания.

Противопоказания: глаукома. Растворы дитилина нельзя смешивать с барбитуратами и донорской кровью.

Форма выпуска: ампулы по 5 мл 2%-ного раствора № 10.

В анестезиологической практике используют и другие препараты: ардуан (*Arduan*), павулон (*Pavulon*), нор-курон (*Norguron*), тракриум (*Tracrium*), мелликтин (*Mel-lictin*). М-, н-холинолитики оказывают блокирующее действие на м- и н-холинорецепторы. Среди них есть вещества, блокирующие преимущественно периферические м- и н-холинорецепторы (периферические м-, н-холинолитики, или спазмолитики) и обладающие спазмолитическим действием. Это спазмолитин, тифен и др. Имеются также препараты, проникающие через гематоэнцефалический барьер и блокирующие м- и н-холинорецепторы ЦНС, применяемые для лечения в основном болезни Паркинсона (циклодол, динезин). Кроме того, есть препараты, обладающие центральным и периферическим м- и н-холиноблокирующим эффектом, например апрофен.

Спазмолитин (*Spasmolythinum*).

Периферический м-, н-холинолитик, оказывающий спазмолитическое действие.

Применение: эндартериит, пилороспазм, спастические колики, язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки. Назначают внутрь, после еды по 0,05—0,1 2–4 раза в день, в/м – 5—10 мл 1%-ного раствора.

Побочные действия: сухость во рту, головная боль, головокружение, боли в эпигастрии, местная анестезия.

Противопоказания: глаукома, работа, требующая быстрой психической и физической реакции. Форма выпуска: порошок.

34. Адренергические средства

Адренергические средства – это лекарственные вещества, оказывающие влияние на адренергические синапсы, находящиеся в области окончания симпатических нервов. Так как адренорецепторы подразделяются на несколько типов (α - и β -) и α -адренорецепторы бывают постсинаптическими α_1 , пресинаптическими и постсинаптическими α_2 , а среди β -адренорецепторов выделяются аналогичные β_1 - и β_2 -адренорецепторы, то все средства, влияющие на передачу возбуждения в адренергических синапсах, делят на три основные группы:

- 1) возбуждающие адренорецепторы – адреноми-метики;
- 2) блокирующие адренорецепторы – адреноблокаторы (адренолитики);
- 3) влияющие на метаболизм, депонирование и выделение медиатора (симпатолитики).

К адреномиметикам относятся средства, возбуждающие адренорецепторы. По действию на определенный тип адренорецепторов адреномиметики подразделяются на три группы:

- 1) стимулирующие преимущественно α -адренорецепторы (α -адреномиметики);
- 2) стимулирующие преимущественно β -адренорецепторы (β -адреномиметики);
- 3) стимулирующие α - и β -адренорецепторы (α -, β -адреномиметики).

α -адреномиметики. К этой группе относится но-радреналин – основной медиатор адренергических синапсов, выделяемый мозговым слоем надпочечников и оказывающий преимущественно стимулирующее действие на α -адренорецепторы, в небольшой степени – на β_1 - и меньше – на β_2 -адренорецепторы.

Норадреналина гидротартрат (Noradrenaiini hydrotartas). Стимулирует α -адренорецепторы, оказывает сильное вазопрессорное действие, стимулирует сокращение сердца, оказывает слабое бронхолитическое влияние.

Применение: острое снижение АД при травмах, хирургические вмешательства, отравления, кардиогенный шок. Вводят в/в (капельно) 2–4 мг препарата (1–2 мл 0,2 %-ного раствора) в 500 мл 5%-ного раствора глюкозы.

Побочные действия: головная боль, озноб, сердцебиение, при попадании под кожу возможны некрозы.

Противопоказания: фторотановый наркоз. Требуется осторожность при выраженном атеросклерозе, недостаточности кровообращения, полной атриовентикулярной блокаде. Форма выпуска: по 1 мл 0,2 %-ного раствора № 10. Список Б.

Мезатон (Mesatonum). Действует преимущественно на α -адренорецепторы, он более стоек, чем норадреналин, и эффективен при назначении внутрь, в/в, в/м, п/к и местно. Применяется так же, как и норадреналин.

Побочное действие и противопоказания: такие же. Форма выпуска: порошок и ампулы по 1 мл 1%-ного раствора. Список Б.

Фетанол (Phetanolum). Повышает артериальное давление по сравнению с мезатоном на более продолжительный срок.

Применение, побочные действия и противопоказания: такие же, как у мезатона.

Форма выпуска: порошок, таблетки по 0,005 г, в ампулах по 1 мл 1%-ного раствора.

Нафтизин (Naphthyzinum). Синоним: Sanorine.

Применение: острые риниты, гаймориты, аллергические конъюнктивы. Сосудосуживающий эффект более продолжительный, чем у норадреналина и мезатона, причем эмульсия санорина действует продолжительнее, чем водный раствор нафтизина.

Форма выпуска: флаконы по 10 мл 0,05–0,1 %-ного раствора.

35. β -адреномиметики, α -и β -адреномиметики

Препараты этой группы оказывают прямое возбуждающее действие на β_1 - или на β_1 - и β_2 -адренорецепторы. Стимуляция β_2 -адренорецепторов, оказывает быстрое и выраженное бронхолитическое действие, уменьшает отек слизистой оболочки бронхов. Повышает функциональную активность β_1 -рецепторов в миокарде, усиливает сердечную деятельность.

Изадрин (Isadrinum).

Применение: эмфизема легких, бронхиальная астма, пневмосклероз. Назначают внутрь по 1–2 таблетке 3–4 раза в день сублингвально, в виде ингаляций – по 0,5–1 мл 0,5–1 %-ного раствора 2–4 раза в день.

Побочные действия: тахикардия, аритмия, тошнота.

Противопоказания: выраженный атеросклероз, аритмия, боли в области сердца.

Форма выпуска: таблетки по 0,005 г № 20; в ампулах по 1 мл 0,5 %-ного раствора № 5, аэрозоль по 25 г. Список Б.

Алупент (Alupent). Близок к изадрину, но при бронхиальной астме действует более продолжительно.

Форма выпуска: ампулы по 1 мл 0,05 %-ного раствора и флаконы по 20 мл 2%-ного раствора для аэрозоля, содержащего 400 разовых доз, таблетки по 0,02 г.

Синоним: Astmopent.

Форма выпуска: флаконы по 20 мл 1,5 %-ного раствора для аэрозоля, содержащего 200 и 400 разовых доз.

Добутамин (Dobutaminum). Увеличивает коронарный кровоток, улучшает кровообращение.

Побочные действия: тахикардия, аритмия, повышение артериального давления, боли в области сердца, тошнота.

Противопоказания: субаортальный стеноз.

Форма выпуска: флаконы по 20 мл (250 мг добутамина). Вводят в/в, предварительно растворив в 0,9 %-ном растворе натрия хлорида. Фенотерол (Fenoterolum).

Синонимы: Berotec. Близок к астмопенту, но действует более длительно. Лучше переносится.

Применение: бронхиальная астма.

Форма выпуска: аэрозоль с дозирующим клапаном, одно нажатие – 0,2 мг препарата; по 1 вдоху 2–3 раза в день. Под названием партусистен (Partusisten) применяется как средство, расслабляющее мускулатуру матки.

Салбутамол (Salbutamolum).

Синоним: Ventolin. Дает выраженный бронхолитический эффект. Прием: внутрь и ингаляционно при бронхиальной астме.

Форма выпуска: аэрозольные баллоны и таблетки по 0,002 г.

α - и β -адреномиметики.

Эти препараты улучшают проводимость нервного импульса в постганглионарных синапсах симпатических нервных волокон. Основные эффекты связаны с прямым или косвенным стимулирующим действием как на α -, так и на β -адренорецепторы.

Адреналина гидрохлорид (Adrenalinum hydrochloridum). Применяется при бронхиальной астме, гипогликемии, аллергических реакциях 1,0 мл 0,1 %-ного раствора, при острой остановке сердца – внутрисердечно, при глаукоме – 1–2 %-ный раствор в каплях.

Побочные действия: тахикардия, усиление сердечного выброса, повышение артериального давления, ухудшение снабжения миокарда кислородом.

Противопоказания: артериальная гипертония, выраженный атеросклероз, сахарный диабет, тиреотоксикоз, беременность, закрытоугольная глаукома.

36. Адреноблокаторы, α -адреноблокаторы

Антиадренергические вещества прерывают проведение эфферентного нервного возбуждения, действуя на постганглионарные синапсы, не влияя на передачу возбуждения в ганглиях. Адреноблокирующие вещества в зависимости от преобладания их влияния на α - или β -адренорецепторы делят на две группы:

- 1) α -адреноблокаторы;
- 2) β -адреноблокаторы.

В свою очередь, α -адреноблокаторы подразделяются на блокаторы α_1 , к которым относятся фентоламин, тропafen, пирроксан и другие, блокаторы α_2 -адренорецепторов (йохимбин).

β -адреноблокаторы делят в зависимости от наличия у них так называемой симпатомиметической активности на:

1) β -адреноблокаторы без внутренней симпатомиметической активности (пропранолол, атенолол, тимолол и др.), значительно уменьшающие сердечный выброс и частоту сердечных сокращений;

2) β -адреноблокаторы с умеренной внутренней симпатомиметической активностью (оксепренолол, ал-пренолол, ацебуталол), незначительно уменьшающие сердечный выброс и частоту сердечных сокращений;

3) β -адреноблокаторы с выраженной внутренней симпатомиметической активностью (пиндолол или вискен), мало влияющие на сердечный выброс и частоту сердечных сокращений. α -адреноблокаторы и лекарственные препараты блокируют передачу возбуждения на α_1 - и α_2 -адренорецепторы. Препараты этой группы применяются при заболеваниях, протекающих на фоне гиперadreналиемии.

α_1 -, α_2 -адреноблокаторы (неселективного действия).

Дигидроэрготамин (Dihydroergotamin).

Является антиадренергическим средством, понижает сосудистый тонус.

Применение: мигрень, коронарospазм, болезнь Рейно.

Способ применения: назначают внутрь по 10–20 капель в 0,5 стакана воды 1–3 раза в день.

Побочные действия: при повышенной чувствительности наблюдаются диспепсические явления.

Противопоказания: выраженный атеросклероз, гипотония, органические поражения сердца, инфаркт миокарда, нарушение функции печени и почек, старческий возраст.

Форма выпуска: флаконы по 10 мл 0,2 %-ного раствора. Список Б.

Фентоламин (Phentolaminum).

α -адреноблокатор, расширяет периферические сосуды, несколько снижает АД, оказывает выраженное гипотензивное действие при феохромоцитоме.

Применение: эндартериит, болезнь Рейно, гипертонические кризы, диагностика и оперативное удаление феохромоцитомы.

Способ применения: назначают внутрь после еды по 0,05 г 3–4 раза в день, возможно – до 0,1 г 3–5 раз в день.

Побочные действия: тахикардия, головокружение, тошнота, рвота, понос, отек слизистой носа, зуд кожи.

Противопоказания: тяжелые органические поражения сердечно-сосудистой системы.

Форма выпуска: таблетки по 0,025, ампулы, содержащие по 0,005 г препарата.

37. β -адреноблокаторы

Угнетают проведение нервного импульса за счет угнетения β_1 – и β_2 -адренорецепторов. β_1 -, β_2 -адреноблокаторы (неселективного действия).

Анаприлин (Anaprilinum). Синонимы: Obsidan, In-deral, Propranolol. Угнетает β_1 – и β_2 -адренорецепторы, обладает антиангинальным, антиаритмическим и гипотензивным действием.

Применение: артериальная гипертензия, стенокардия, синусовая аритмия, тахикардия, тиреотоксический криз. Назначают внутрь по 10 мг 3 раза в день, постепенно увеличивая дозу до 20–40 мг 3–4 раза в день (иногда до 200 мг в сутки).

Побочные действия: слабость, брадикардия, гипотония, бронхоспазм, тошнота, понос, нарушение сна, возбуждение, депрессия.

Противопоказания: инфаркт миокарда, гипотония, бронхиальная астма, нарушение проводимости, болезнь Рейно и другие облитерирующие заболевания сосудов.

Форма выпуска: таблетки по 0,01 и 0,04 г № 50, ампулы по 5 мл 0,25 %-ного раствора № 10.

Окспренолол (Oxprenololum), синонимы: Trasicor, Coretal.

Близок к анаприлину, но оказывает менее выраженное влияние на силу и частоту сердечных сокращений.

Применение: стенокардия, аритмия, гипертензия.

Форма выпуска: таблетки по 0,02. Принимают по 1 таблетке 2–3 раза в день (можно – до 2–3 таблеток 2–3 раза в сутки).

Пиндолол (Pindololum).

Побочные явления и противопоказания: как у анаприлина.

Форма выпуска: таблетки по 5 мг № 30; ампулы по 5 мл 0,02 %-ного раствора № 5. Надолл (Nadololum).

Синоним: Corgard. β -адреноблокатор неселективного действия.

Применение: ишемическая болезнь сердца, ранние стадии гипертонической болезни.

Побочные эффекты: нарушение функции ЖКТ, брадикардия, бессонница.

Противопоказания: бронхиальная астма, блокада и пороки сердца, заболевания печени, почек, беременность. Выпускается в таблетках по 0,04 и 0,08 г, назначается по 2 таблетке 1 раз в день.

Тимолол (Timololum).

Близок к анаприлину.

Применение: глаукома (возможна тахифилаксия), назначают по 1 капле 2 раза в день.

Форма выпуска: флаконы по 3 и 5 мл 0,5 %-ного раствора.

β_1 -адреноблокаторы (селективного действия).

Корданум (Cordanum), синоним (Talinolol).

Уменьшает сократительную способность миокарда и величину сердечного выброса.

Применение: ишемия сердца, артериальная гипертензия, нарушение сердечного ритма – по 50 мг 3 раза в день, можно до 300 мг в день.

Побочные действия: головная боль, тошнота, головокружение.

Противопоказания: сердечная недостаточность, кардиогенный шок, нарушение проводимости сердца и периферического кровообращения, заболевания бронхов и легких.

Форма выпуска: драже по 50 мг № 50.

38. Симпатолитики

Симпатолитические средства нарушают депонирование норадреналина, а также его освобождение из окончаний симпатических нервных волокон. К симпатолитикам относятся резерпин, раунатин, изобарин, ор-нид, допегит, метилдофа.

Резерпин (Reserpinum), синонимы: Rausedil, Serpasil.

Оказывает гипотензивное и седативное действие.

Применение: гипертоническая болезнь, психические заболевания сосудистой этиологии, психозы на фоне повышения артериального давления.

Способ применения: назначают внутрь по 0,1–0,25 мг на прием до 1 мг в сутки, В. Р. Д. – 1 мг, В. С. Д. – 2 мг. Рекомендуется чередовать с другими гипотензивными средствами.

Побочные действия: гиперемия слизистых оболочек глаз, диспепсия, брадикардия, депрессия, головокружение.

Противопоказания: язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, заболевания почек с нарушением функции, органические заболевания сердечно-сосудистой системы.

Форма выпуска: таблетки по 0,1 мг, 0,25 мг № 50. Рауседил – ампулы по 1 мл 0,1–0,25 %-ного раствора. Входит в состав комбинированных препаратов: адельфана, трирезиды, кристепина (бринердина), адельфан-эзидрекса, адельфан-эзидрекса-К.

Раунатин (Raunatinum), синоним: раувазан (Rau-wasan).

Содержит сумму алкалоидов корней раувольфии змеиной. Оказывает гипотензивное, антиаритмическое, седативное действие. По действию подобен резерпину.

Побочные эффекты: потливость, слабость, боли в сердце.

Противопоказания: гипотензия.

Форма выпуска: таблетки по 0,002 г, драже раувазана по 0,002. Назначается по 1 таблетке (драже) 3 раза в день не более 6 таблеток (драже) в день. Список Б.

Октадин (Octadinum), синонимы: Isobarin, Gaune-thidine Sulfate, Ismelin.

Оказывает выраженное гипотензивное действие, которому предшествует небольшая (от нескольких минут до часа) гипертензивная реакция при парентеральном введении. Действие октадина на глаз проявляется в сужении зрачка и снижении внутриглазного давления. Октадин несколько повышает моторику желудочно-кишечного тракта.

Применяют для лечения гипертонии, реже глаукомы.

Побочные эффекты: нарушение функции ЖКТ, брадикардия.

Форма выпуска: таблетки и драже по 0,025 г. Назначается по 1 таблетке 3 раза в день с контролем артериального давления.

Орнид (Ornidum).

Применение: аритмия, гипертонические кризы.

Побочные эффекты: тошнота, головокружение, ухудшение зрения, возможно привыкание.

Противопоказания: атеросклероз, инфаркт миокарда, нарушения мозгового кровообращения.

Форма выпуска: ампулы по 1 мл 5%-ного раствора. Назначается в/м по 0,1–0,5 мл 2–3 раза в день. Список Б.

Метилдофа (Methyldopa), допегит (Dopegyt), альдомет (Aldomet).

Применение: гипертоническая болезнь. Начинают лечение с 0,25–0,5 г, доводя дозу до 0,75–1 г, при недостаточном эффекте – до 1,5–2,0 г в сутки. Сочетают с салуретиками и гипотензивными средствами.

39. Дофамин

Дофамин – биогенный амин, образующийся из L-тирозина и являющийся предшественником норадреналина и адреналина и медиатором, взаимодействующим с α - и β -адренорецепторами, а также со специфическими рецепторами, получившими название дофаминовых и расположенных в различных областях организма. Много дофаминовых рецепторов в различных областях ЦНС. Их можно разделить на пресинаптические и постсинаптические. Кроме того, постсинаптические дофаминовые рецепторы могут быть разделены на D1, связанные с действием дофамина на активность фермента аденилатциклазы, и D2, не связанные с этим действием. В зависимости от степени стимуляции дофамином или блокирования нейрорептиками этих рецепторов они подразделяются на четыре типа: D1—D4. Вещества, стимулирующие дофаминовые рецепторы, называются дофаминомиметиками, или агонистами дофаминовых рецепторов, а вещества, блокирующие дофаминовые рецепторы, – дофаминолитиками, или антагонистами дофаминовых рецепторов.

Дофаминомиметики.

Эти вещества подразделяются на две группы:

- 1) непрямого действия, влияющие на пресинаптические дофаминовые рецепторы, регулирующие синтез и выделение дофамина и норадреналина;
- 2) прямого действия, влияющие на постсинаптические дофаминовые рецепторы.

К первой группе непрямого действия из отечественных препаратов относятся леводопа, мидантан и другие, стимулирующие синтез дофамина и предположительно задерживающие его разрушение, способствующие освобождению дофамина из гранул пресинаптических окончаний, применяемые для лечения болезни Паркинсона.

Вторая группа – психостимуляторы, обладающие дофаминергическими свойствами (фенамин (амфетамин)), способствующие освобождению дофамина и норадреналина из гранул пресинаптических нервных окончаний и тормозящие активность МАО и обратный нейрональный захват дофамина. Меридил (метилфенилат) – психостимулятор, обладающий способностью освобождать дофамин из гранул пресинаптических нервных окончаний.

Дофамин (Dofaminum).

Стимулятор прямого действия на дофаминовые рецепторы. Повышает силу сердечных сокращений и уровень артериального давления, увеличивает сердечный выброс, уменьшает сопротивление почечных сосудов, увеличивая в них кровоток, а также диурез.

Применение: шок различной этиологии, острая сердечно-сосудистая и почечная недостаточность, кардиохирургические операции.

Способ применения: вводят в/в капельно, предварительно растворив в 5 %-ном растворе глюкозы или 0,9 %-ном растворе натрия хлорида (в 1 мл должно быть 500 мкг дофамина). Инфузии проводят непрерывно – от 2–3 ч до 1–4 суток под мониторным наблюдением. Суточная доза в среднем – 800 мкг.

Побочные действия: спазм периферических сосудов, тахикардия, желудочковая экстрасистолия, нарушение дыхания, головная боль, возбуждение.

Противопоказания: феохромоцитома, ингибиторы моноамино-оксидазы, средства для наркоза.

Форма выпуска: ампулы по 5 мл 0,5 %-ного раствора № 10. Список Б.

40. Гистамин. Гистаминомиметики

Гистамин является одним из медиаторов, участвующих в регуляции жизненно важных функций организма и играющих важную роль в патогенезе ряда болезненных состояний. Обычно гистамин находится в организме в связанном, неактивном состоянии. Количество гистамина увеличивается при различных патологических состояниях организма: травмах, стрессе, аллергических реакциях. Тогда наряду с гистамином освобождаются и другие биологически активные вещества: серотонин, брадикинин, ацетилхолин, субстанция анафилактики, про-стагландины и др. Количество гистамина увеличивается и при введении в организм различных ядов (растительных, животных, бактериальных), пищевых продуктов (земляники, яичного белка, др.), а также некоторых лекарственных веществ – холинолитиков, новокаина, антибиотиков и др. В организме существуют специфические рецепторы, названные гистаминовыми, или H-рецепторами, медиатором которых является гистамин. Гистаминовые рецепторы (H1 и H2) имеют различную локализацию в организме. При стимуляции H1-рецепторов повышается тонус гладких мышц кишечника, бронхов, мочевого пузыря, стимуляция H2-рецепторов повышает секрецию желез желудка, регулирует работу слюнных желез, расслабляет гладкую мускулатуру матки. Через H1– и H2-рецепторы осуществляется регуляция уровня артериального давления, проницаемости капилляров, коронарных сосудов. Все гистаминергические средства делятся на две основные группы:

- 1) стимуляторы H1– и H2-рецепторов – гистаминомиметики;
- 2) блокаторы H1– и H2-рецепторов – антигистаминные средства.

Гистаминомиметики.

Эти вещества возбуждают H1– и H2-гистаминовые рецепторы и вызывают характерные для гистамина эффекты.

Гистамин (Histaminum).

В медицинской практике применяют гистамина дигидрохлорид. Вызывает спазм гладкой мускулатуры, расширение капилляров и снижение АД, учащение сердечных сокращений, усиление секреции желудочного сока.

Применение: полиартриты, ревматизм, боль, вызванная поражением периферических нервов, аллергические заболевания, для диагностики и инструментальных исследований.

Способ применения: вводят в/к, п/к и в/м по 0,2–0,5 мл 0,1 %-ного раствора, для электрофореза – 0,1 %-ный раствор.

Побочные действия: при передозировке – коллапс, шок.

Форма выпуска: ампулы по 1 мл 0,1 %-ного раствора № 10. В качестве диагностических средств для определения секреторной функции желудка применяют гисталог (Gystalog), бетазол (Betazol), тидазин (Tytazin), проявляющие большую избирательную активность в отношении H2-рецепторов.

Антигистаминные препараты.

Подразделяются на две группы:

- 1) вещества прямого действия;
- 2) вещества непрямого действия, эффект которых реализуется через медиатор, синтез или выделение которого изменяется при введении этих веществ.

Антигистаминные препараты прямого действия.

Среди этой группы препаратов можно выделить вещества, блокирующие H1-рецепторы (H1-блокаторы) и H2-рецепторы (H2-блокаторы).

41. Антигистаминные препараты

Димедрол (Dimedrolum). Оказывает противогиста-минное, холинолитическое и седативное действие.

Применение: аллергические заболевания (крапивница, сенная лихорадка, аллергический конъюнктивит, отек Квинке и др.), паркинсонизм, хорей, болезнь Меньера, в качестве успокаивающего и снотворного средства.

Способ применения: назначают внутрь, в/м, в/в, местно (накожно, в виде глазных капель, на слизистую оболочку носа), ректально. Под кожу не вводят из-за раздражающего действия. Назначают внутрь по 0,025–0,05 г 1–3 раза в день, в/м и в/в – по 1–5 мл 1%-ного раствора, в виде глазных капель (0,2–0,5 %-ный раствор). В. Р. Д. – 0,1 г, В. С. Д. – 0,25 г, в/м – 0,05 и 0,15 г соответственно.

Побочные действия: головокружение, головная боль, сухость во рту, тошнота, сонливость, общая слабость.

Противопоказания: лицам, профессия которых требует быстрой реакции.

Форма выпуска: порошок, таблетки по 0,05 г № 10, по 0,02 № 6 для детей, ампулы по 1 мл 1%-ного раствора № 10, суппозитории ректальные по 0,01 г № 10 для детей, палочки по 0,05 г № 10.

Дипразин (Diprazinum). Синоним: Pipolphen. Обладает сильной противогистаминной активностью, более активен, чем димедрол. Оказывает седативное действие.

Применение: аллергические заболевания, ревматизм с выраженным аллергическим компонентом, аллергические осложнения, вызванные лекарственными средствами, зудящие дерматозы, болезнь Меньера и др.

Способ применения: назначают внутрь по 0,025 г 2–3 раза в день, в/м – 1–2 мл 2,5 %-ного раствора; ПТб в/в (в составе литических смесей) – до 2 мл

2,5 %-ного раствора. Детям – в соответствии с возрастом. В. Р. Д. – 0,075 г, В. С. Д. – 0,5 г; в/м разовая – 0,05 г, суточная – 0,25 г.

Побочные действия: сухость во рту, тошнота. При в/м введении – болезненные инфильтраты, при в/в – резкое понижение АД.

Противопоказания: алкогольное опьянение, лицам, работа которых требует быстрой реакции.

Форма выпуска: таблетки, покрытые оболочкой, по 0,025 и 0,005 № 10, ампулы по 2 мл 2,5 %-ного раствора № 10.

Тавегил (Tavegil). Синоним: Olemastinum. Анти-гистаминный препарат пролонгированного действия с умеренным седативным эффектом, усиливает действие снотворных и алкоголя.

Применение: такое же, как у дипразина.

Способ применения: назначают внутрь по 0,001 г 2 раза в день, при необходимости – до 0,004 г. Детям от 6 до 12 лет – 0,0005–0,001 г 2 раза в день.

Побочные действия: головная боль, запор, сухость во рту. Противопоказания: лицам, работа которых требует напряженной физической и психической деятельности.

Форма выпуска: таблетки по 0,001 г № 20, по 2,5 мг № 20, ампулы по 2 мл 0,1 %-ного раствора (2 мг) № 5.

Фенкарол (Phencarolum). В отличие от димедрола и дипразина не оказывает седативного и снотворного эффекта. Применение: как и к другим препаратам этой группы, можно назначать лицам, работа которых требует быстрой реакции.

Способ применения: назначают внутрь по 0,025– 0,05 г 3–4 раза в день, но с осторожностью больным тяжелыми заболеваниями сердечно-сосудистой системы, печени и язвенной болезни, 1-й триместр беременности.

42. Гистодил, ранитидин, кетотифен

H₂-блокаторы избирательно блокируют H₂-рецепторы, оказывая угнетающее действие на секрецию желудка, вызванную гистамином, и частично устраняя гистаминовую гипотензию.

Гистодил (Histodil). Синоним: Cimetidin. Блокатор H₂-рецепторов. Антигистаминное средство, уменьшает секрецию хлористо-водородной кислоты в желудке.

Применение: для лечения доброкачественной опухоли желудка и двенадцатиперстной кишки, реф-люкс-эзофагита, синдрома Золлингера—Эллисона, неактивной фазы эрозивных желудочных геморрагий.

Способ применения: назначают внутрь по 200 мг 3 раза в день во время еды и по 400 мг перед сном (1 г в сутки). Можно также вводить в/м или в/в медленно в дозе 200 мг, при необходимости повторить через 4–6 ч.

Побочные действия: головокружение, утомляемость, сыпь, редко нефрит или острый панкреатит, проходящий при отмене препарата.

Противопоказания: с осторожностью при беременности, лактации, заболеваниях печени, почек, систем кровообращения.

Форма выпуска: таблетки по 200 мг № 50, ампулы по 2 мл 10 %-ного раствора № 10.

Ранитидин (Ranitidinum).

Синоним: Ranisan. Мощный блокатор H₂-гиста-миновых рецепторов.

Показания к применению, побочное действие, противопоказания: как у циметидина.

Способ применения: принимают по 1 таблетке 2 раза в день (утром и вечером) независимо от приема пищи. Курс лечения – 4–6 недель.

Для профилактики – по 1 таблетке вечером перед сном в течение 12 месяцев, каждые 4 месяца – эндоскопия. При синдроме Золлингера—Эллисона – по 1 таблетке 3 раза в день, при необходимости – до 4–6 таблеток в день. Больным с ограниченной почечной функцией (уровень креатина в сыворотке крови превышает 3,3 мг (100 мл)) – ежедневно 1/2 таблетки 2 раза в день.

Форма выпуска: таблетки по 150 мг № 20, 50. Антигистаминные средства непрямого действия.

Эти препараты действуют опосредованно, нарушая синтез гистамина и уменьшая количество свободного гистамина.

Кетотифен (Ketotifenum).

Синоним: Zaditen. Противоаллергическое средство, тормозит высвобождение гистамина в организме, препятствуя тем самым возникновению анафилаксии, отеку слизистых оболочек, бронхоспазму и другим проявлениям аллергической реакции.

Применение: профилактика и лечение бронхиальной астмы аллергического происхождения. Аллергический ринит.

Способ применения: принимают по 1 таблетке утром и вечером во время еды. Больным, чувствительным к седативному действию препарата, вначале назначают по 1/2 таблетки в день, постепенно повышая дозу до 2 мг в день. При необходимости суточная доза увеличиваться до 4 мг (по 2 таблетки 2 раза в день). Детям старше 3 лет – 0,025 мг/кг массы тела 2 раза в день.

Побочные действия: в начале лечения – седатив-ный эффект, иногда сухость во рту, легкое головокружение. Эти явления проходят без прекращения лечения.

Противопоказания: беременность, перораль-ные антидиабетические и другие препараты, вызывающие тромбоцитопению.

Форма выпуска: капсулы и таблетки по 0,001, сироп, содержащий в 1 мл 0,2 мг препарата.

43. Супрастин, диазолин, кромолин-натрий

Применение, побочное действие и противопоказания: как у димедрола.

Форма выпуска: таблетки по 0,025 № 20, ампулы по 1 мл 2%-ного раствора № 5.

К этой группе относится и диазолин (Diazolinum), не оказывающий седативного и снотворного действия, но из-за раздражения слизистой оболочки желудка лучше применять после еды в драже.

Форма выпуска: таблетки и драже по 0,05 и 0,1 № 20. Список Б.

Кромолин-натрий (Cromolyn Sodium).

Синоним: Intal. Препятствует высвобождению гистамина из тучных клеток, предупреждает спазмы бронхов.

Применение: бронхиальная астма.

Способ применения: для ингаляций (1 капсула 3–4 раза в день) с помощью турбохалера. Можно применять в сочетании с бронхорасширяющими средствами и кортикостероидами. Ингаляции проводят ежедневно. Начинают с 4 капсул в сутки (с промежутками в 6 ч). В тяжелых случаях – до 8 капсул в сутки (каждые 3 ч по 1 капсуле). После улучшения состояния количество ингаляций постепенно уменьшают, подбирая эффективную поддерживающую дозу.

Побочные действия: в отдельных случаях раздражение гортани и горла, особенно в период респираторных заболеваний, иногда кашель и кратковременный бронхоспазм. Кашель успокаивают приемом стакана воды сразу после ингаляции, а в случае повторного бронхоспазма делают предварительную ингаляцию бронхорасширяющего средства.

Противопоказания: беременность, возраст до 5 лет, с осторожностью больным с поражением печени и почек.

Форма выпуска: капсулы по 0,02 г № 30 и турбохалер.

Серотонин и серотонические и антисеротониновые препараты.

Серотонин, или 5-окситриптамин, является биогенным амином, образующимся в организме в результате превращения аминокислоты L-триптофана. Накапливается в синаптических пузырьках и выделяется под влиянием нервных импульсов, взаимодействуя со специфическими рецепторами, обозначаемыми как серотониновые (серотонинергические). Различают 5-HT₁ (или B₁-) – рецепторы, 5-HT₂ (или B₂-) – рецепторы, 5-HT₃ (или B₃-) – рецепторы. 5-HT₂-рецепторы содержатся в гладких мышцах стенок сосудов, в бронхах и тромбоцитах. 5HT₁– и 5HT₃-рецепторы содержатся в гладкой мускулатуре и слизистой оболочке ЖКТ. 5HT₃-рецепторы содержатся в периферических тканях и в ЦНС. Серотонин играет роль медиатора в ЦНС. В патогенезе депрессий и механизме действия антидепрессантов отводится большая роль серотонину. Предполагают, что развитие тошноты и рвоты может быть обусловлено стимуляцией серотониновых 5HT₃-рецепторов, локализующихся в области рвотного центра. Периферическое действие серотонина характеризуется сокращением гладких мышц матки, кишечника, бронхов и других гладкомышечных органов, сужением кровеносных сосудов. При местном применении он оказывает выраженное отечное действие, обладает способностью укорачивать время кровотечения, повышать агрегацию тромбоцитов, при которой высвобождается серотонин. В медицинской практике применяются серотонин и его производные, а также некоторые его антагонисты.

44. Серотонина адипинат

Серотонина адипинат (Serotonini adipinas). Гемостатическое средство.

Применение: патологические состояния, сопровождающиеся геморрагическим синдромом (болезнь Верльгофа, тромбоастения и др.).

Способ применения: вводят в/в капельно (в 100–150 мл 0,9 %-ного раствора натрия хлорида) или в/м (в 5 мл 0,5 %-ного раствора новокаина) начиная с 0,005 и до 0,01 г при отсутствии побочных явлений, в/м вводят 2 раза в сутки с интервалом не менее 4 ч. Суточная доза для взрослых – 0,015–0,02 г. Курс лечения – до 10 дней.

Побочные действия: при быстром введении в вену возникают боль по ходу вены и в животе, неприятные ощущения в области сердца, повышение АД, тяжесть в голове, затруднение дыхания, тошнота, рвота, уменьшение диуреза, боль в месте инъекции при в/м введении.

Противопоказания: гломерулонефрит, заболевания почек, сопровождающиеся анурией, гипертоническая болезнь II–III стадии, острые тромбозы, отек Квинке, бронхиальная астма, повышенная свертываемость крови.

Форма выпуска: ампулы по 1 мл 1 %-ного раствора № 10. Список Б.

Мексамин (Mexaminum).

Близок к серотонину. Вызывает сокращение гладкой мускулатуры, сужение кровеносных сосудов, оказывает седативное действие, усиливает эффект снотворных и анальгетиков. Обладает радиозащитной активностью.

Применение: профилактика общей лучевой реакции при лучевой терапии. Назначают внутрь от 0,05 до 0,1 г за 30–40 мин перед каждым сеансом.

Побочные действия: легкая тошнота, боль в подложечной области, реже рвота.

Противопоказания: выраженный склероз сосудов сердца и мозга, сердечно-сосудистая недостаточность, бронхиальная астма, беременность, заболевание почек с нарушением их функции.

Форма выпуска: таблетки, покрытые оболочкой, по 0,05 г № 50.

Имигран (Imigran).

Активное вещество суматриптан, специфический стимулятор 5HT₁-серотониновых рецепторов.

Применение: для быстрого купирования приступов мигрени.

Способ применения: только после возникновения приступа мигрени по 50 мг, возможно до 100 мг.

Побочные действия: головокружение, сонливость, тошнота и рвота, артериальная гипертония, брадикардия, аллергические реакции.

Противопоказания: органические заболевания сердечно-сосудистой системы, ингибиторы моноами-нооксидазы, эрготамин и его производные.

Форма выпуска: таблетки по 50 и 100 мг № 6.

Зофран (Zofran).

Активное вещество ондансетрон, селективный антагонист 5HT₃-серотониновых рецепторов, предупреждает или устраняет тошноту и рвоту, вызванную химио-или лучевой терапией, а также после операции.

Применение: тошнота и рвота после операций, химио- или лучевой терапии.

Способ применения: внутрь и парентерально по 8 мг, возможно до 32 мг.

Побочные действия: головная боль, запор, боли в грудной клетке, гипотония, брадикардия.

Форма выпуска: таблетки по 4 и 8 мг № 10, ампулы для инъекций по 2 и 4 мл (по 2 мг в 1 мл активного вещества).

45. Местноанестезирующие средства

Препараты этой группы избирательно блокируют процесс передачи возбуждения в эфферентных нервах и их окончаниях, вызывая потерю болевой чувствительности в месте их введения.

Существуют различные виды местной анестезии:

- 1) поверхностная (терминальная) анестезия (нанесение анестетиков на поверхность кожи, слизистых оболочек глаз, носа и др.);
- 2) проводниковая анестезия (введение анестетика в нерв или около него);
- 3) спинномозговая анестезия (раствор анестетика вводят непосредственно в спинномозговой канал);
- 4) инфильтрационная анестезия (анестетиком послойно пропитывают ткани какого-либо участка тела).

Анестезин (Anaesthesinum).

Применение: назначают внутрь при болях в желудке, повышенной чувствительности пищевода по 0,3 г 3–4 раза в день; наружно в виде 5–10 %-ной мази и присыпок при крапивнице и заболеваниях кожи, сопровождающихся зудом, для обезболивания язвенных и раневых поверхностей; в свечах по 0,05–0,1 г при заболеваниях прямой кишки (при трещине, зуде, геморрое).

Противопоказания: индивидуальная повышенная чувствительность.

Форма выпуска: порошок, таблетки по 0,3 г № 10. Новокаин (Novocainum).

Применение: все виды анестезии, вагосимпатическая и паранефральная блокада для потенцирования действия основных наркотических средств, при общей анестезии, для купирования боли при язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, при трещинах заднего прохода, геморрое и др.

Способ применения: при инфильтрационной анестезии высшие дозы в начале операции составляет не более 500 мл 0,25 %-ного раствора или 150 мл 0,5 %-ного раствора, далее на каждый час до 1000 мл 0,25 %-ного раствора или 400 мл 0,5 %-ного раствора в течение каждого часа. Для проводниковой анестезии применяют 1–2 %-ные растворы, перидуральной – 20–25 мл 2 %-ного раствора, спинномозговой – 2–3 мл 5 %-ного раствора, при паранефральной блокаде – 50–80 мл 50 %-ного раствора, вагосимпатической блокаде – 30–100 мл 0,25 %-ного раствора.

Побочные действия: головокружение, слабость, гипотония, аллергия.

Противопоказания: индивидуальная непереносимость.

Форма выпуска: порошок; ампулы по 2 мл 0,5, 1– и 2 %-ного раствора № 10, ампулы по 5 мл 0,5– и 2 %-ного раствора № 10; ампулы по 10 мл 0,5, 1 и 2 %-ного раствора № 10, ампулы по 1 мл 2 %-ного раствора № 10, по 400 мл 0,25 и 0,5 %-ного раствора, суппозитории ректальные, содержащие 0,1 г новокаина, № 10. Список Б.

Лидокаин (Lidocainum).

Применение: местная анестезия. Желудочковые экстрасистолия и тахикардия, особенно в острой стадии инфаркта миокарда и вследствие интоксикации препаратами наперстянки.

Способ применения: назначают только в/м, общая доза не более 300 мг.

Противопоказания: тяжелые функциональные расстройства печени.

Побочные действия: головная боль, головокружение, сонливость.

Форма выпуска: раствор 10 %-ный в ампулах по 2 мл № 10 и 2 %-ный раствор в ампулах по 2 и 10 мл.

46. Вяжущие средства

Вяжущие средства при нанесении на слизистые оболочки вызывают коагуляцию белков, образуемая пленка предохраняет слизистую от раздражающих факторов, уменьшаются болевые ощущения и ослабляются воспалительные процессы. Такое действие оказывают многие вещества растительного происхождения, а также слабые растворы солей некоторых металлов.

Танин (Taninum).

Галлодубильная кислота. Обладает вяжущим и противовоспалительным действием.

Применение: стоматиты, гингивиты, фарингиты (1–2 %-ный раствор для полосканий (3–5 раз в день), наружно при ожогах, язвах, трещинах, пролежнях (3–10 %-ные растворы и мази), отравление алкалоидами, солями тяжелых металлов (0,5 %-ный водный раствор для промывания желудка).

Форма выпуска: порошок.

Тансал (Tansal).

Состав: танальбина – 0,3 г, фенилсалицилата – 0,3 г. Вяжущее и дезинфицирующее средство.

Применение: острые и подострые энтериты и колиты (по 1 таблетке 3–4 раза в день).

Форма выпуска: таблетки № 6.

Трава зверобоя (Herba Hyperici).

Содержит дубильные вещества типа катехинов, гиперозид, азулен, эфирное масло и другие вещества.

Применение: как вяжущее и антисептическое средство при колитах в виде отвара (10,0—200,0 г) по 0,3 стакана 3 раза в день за 30 мин до еды, для полоскания рта в виде настойки (30–40 капель на стакан воды).

Форма выпуска: трава резаная по 100,0 г, брикеты по 75 г, настойка (Tinctura Hyperici) во флаконах по 25 мл.

Кора дуба (Cortex Quercus).

Применение: как вяжущее средство в виде водного отвара (1: 10) для полосканий при гингивитах, стоматитах и других воспалительных процессах полости рта, глотки, гортани, наружно для лечения ожогов (20 %-ный раствор).

В лечебной практике применяют также настои и отвары таких растений, как: корневище змеевика (Rhizoma Bistortae), корневище и корень кровохлебки (Rhizoma cum radicibus Sanguisorbae), соплодия ольхи (Fructus Alni), листья шалфея (Folium Salviae), препарат из него – сальвин (Salvinum), цветки ромашки (Flores Chamomillae), препарат из ромашки; ромазулан (Roma-sulon), ягоды черники (Baccae Murtilli), плоды черемухи (Baccae Pruniracemosae), корневище лапчатки (Rhizoma Tormentillae), трава череды (Herba Bidentis).

Соли металлов. Препараты висмута.

Висмута нитрат основной (Bismuthi subnitras).

Применение: как вяжущее, слабое антисептическое, закрепляющее средство при желудочно-кишечных заболеваниях назначают внутрь по 0,25—1 г (детям по 0,1–0,5 г) на прием 4–6 раз в день за 15–30 мин до еды.

Побочные действия: при длительном применении в больших дозах возможна метгемоглобинемия.

Форма выпуска: порошок, входящий в состав таблеток «Викаир», применяемых при язве желудка и двенадцатиперстной кишки, и суппозитории «Нео-Анузол», которые применяются при геморрое.

Ксероформ (Xeroformium).

Применяют наружно как вяжущее, подсушивающее и антисептическое средство в порошках, присыпках, мазях (3—10 %-ные). Входит в состав линимента бальзамического (мази Вишневского).

47. Обволакивающие средства и адсорбирующие средства

Обволакивающие средства.

Обволакивающие средства образуют в воде коллоидные растворы – слизи, покрывающие слизистые оболочки и защищающие их от действия раздражающих веществ.

Используют их для лечения воспалительных заболеваний ЖКТ, а также для уменьшения раздражающего действия некоторых лекарственных средств. В качестве обволакивающих средств применяют крахмальную слизь, слизь из семени льна.

Альмагель (Almagel).

Комбинированный препарат, в 5 мл которого содержится 4,75 геля алюминия гидроксида, 0,1 г магния окиси с добавлением D-сорбита.

Применение: язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, гиперацидные гастриты и другие заболевания желудка. В альмагель А входит еще и 0,1 г анестезина, его применяют при наличии сопутствующей боли. Назначают по 1–2 ч. л. 4 раза в день за 30 мин до еды.

Семя льна (Semen).

Назначают наружно для припарок, внутрь в качестве обволакивающего и смягчающего средства в виде слизи (*Mucilago seminis Lini*), которую готовят из 1 части цельного льняного семени и 30 частей горячей воды *ex tempore*.

Адсорбирующие средства.

Обладают способностью предохранять слизистые оболочки от раздражения, замедлять всасывание из ЖКТ различных веществ при отравлениях.

Карболен (*Carbolenum*).

Уголь активированный (*Tabulettae Carbonis activi*) способен адсорбировать газы, алкалоиды, соли тяжелых металлов, токсины и др.

Применение: как адсорбирующее средство при диспепсии, метеоризме, принимают внутрь по 1–3 таблетки 2–4 раза в день.

Форма выпуска: таблетки по 0,25 г № 10.

Глина белая (*Bolus alba*).

Применение: как обволакивающее и адсорбирующее средство принимают внутрь (10–100 г) при желудочно-кишечных заболеваниях (колитах, энтеритах), наружно в виде присыпок, мазей, паст при кожных заболеваниях.

Форма выпуска: порошок.

Смекта (*Smecta*).

Антидиарейное средство. Суспензия обладает значительными сорбционными свойствами и обволакивающей способностью, защищая слизистую оболочку пищеварительного тракта от отрицательного действия ионов H.

Применение: острая и хроническая диарея, особенно у детей, симптоматическая боль, связанная с заболеваниями пищевода, желудка, двенадцатиперстной.

Способ применения: для получения однородной суспензии содержимое пакетика высыплют в 0,5 стакана воды и перемешивают. Для детей порошок можно растворить в каше, пюре, компоте, в детском рожке объемом 50 мл (из расчета: до года – 1 пакетик в день, от 1 года до 2 лет – 2 пакетика в день, старше 2 лет – по 2–3 пакетика в день). Взрослым – по 3 пакетика в день.

Форма выпуска: порошок для приготовления суспензии по 3 г активного вещества № 30.

48. Средства, содержащие эфирные масла. Горечи. Средства, содержащие аммиак

Средства, содержащие эфирные масла.

Лист эвкалипта (*Folium Eucalypti*).

Применение: отвар и настой эвкалипта как антисептическое средство для полосканий и ингаляций при лор-заболеваниях, а также для лечения свежих и инфицированных ран, воспалительных заболеваний женских половых органов.

Настойка эвкалипта (*Tinctura Eucalypti*).

Применение: по 15–30 капель на прием, для полосканий – по 10–15 капель на стакан воды.

Масло эвкалиптовое (*Oleum Eucalypti*).

Применение: по 15–20 капель на стакан воды.

Семя горчицы (*Semen Sinapis*).

Из его обезжиренных семян получают эфирное горчичное масло (*Oleum Sinapis aethereum*).

Горчичники (*Oharta Sinapis*).

При смачивании теплой водой ощущается сильный запах эфирного горчичного масла. Применяют в качестве противовоспалительного средства. В смоченном виде накладывают на кожу на 5–15 мин до появления выраженного покраснения. Нельзя накладывать на поврежденную кожу.

Плод перца стручкового (*Fructus Capsici*).

Содержит капсицин.

Препараты из него: настойка перца стручкового (*Tinctura Capsici*), линимент перцово-камфарный

(*Linimentum Capsici camphoratum*), пластырь перцовый (*Emplastrum Capsici*).

Применение: как отвлекающее средство при невралгии, миозитах и пр. Перед наложением пластыря кожу обезжиривают спиртом или одеколоном и протирают насухо.

Горечи.

Горечи (*amara*) – препараты растительного происхождения, содержащие вещества, обладающие сильным горьким вкусом. Раздражая вкусовые рецепторы слизистых оболочек полости рта и языка, они вызывают рефлекторным путем усиление секреции желудочного сока, повышение аппетита, улучшение пищеварения. Назначают при гипацидных и хронических атрофических гастритах, при анорексии на почве нервных заболеваний, после перенесенных оперативных вмешательств. Принимают 2–4 раза в день за 15–20 мин до еды с небольшим количеством воды.

Противопоказания: повышенная желудочная секреция, язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, рефлюкс-эзофагит. К этой группе относятся трава золототысячника (*Herba Gentaurii*), трава полыни горькой (*Herba Absinti*), лист трилистника водяного (*Folium Menyanthidis*), корень одуванчика (*Radix Taraxaci*), корневище аира (*Rhizoma Calami*).

Применяют в виде настоев и отваров.

Средства, содержащие аммиак.

Раствор аммиака 10 %-ный (*Solutio Ammonii caustici*).

Применение: как средство скорой помощи для возбуждения дыхания и выведения больных из обморочного состояния, иногда применяют внутрь в качестве рвотного средства (по 5–10 капель на 100 мл воды). При укусах насекомых – наружно в виде примочек.

Противопоказания: дерматиты, экземы.

Форма выпуска: флаконы по 40 мл и ампулы по 1 мл № 10.

49. Средства, стимулирующие отхаркивание

Вызывают усиление секреции и разжижение бронхиальной слизи (мокроты), что облегчает ее отделение при кашле. Подразделяются на две группы:

- 1) средства, стимулирующие отхаркивание (секрето-моторные);
- 2) муколитические средства (бронхосекретолитические).

Секретомоторные препараты усиливают физиологическую активность мерцательного эпителия и перистальтические движения бронхиол, способствуя продвижению мокроты из нижних отделов в верхние отделы дыхательных путей и ее выведению. Эффект обычно сочетается с усилением секреции бронхиальных желез и некоторым уменьшением вязкости мокроты. Условно препараты этой группы подразделяют на две подгруппы: рефлекторного и резорбтивного действия.

Препараты рефлекторного действия (препараты термопсиса, истода, алтея и других лекарственных растений, натрия бензоат, терпингидрат и др.). При приеме внутрь оказывают умеренное раздражающее действие на рецепторы слизистой оболочки желудка и рефлекторно влияют на бронхи и бронхиальные железы. Эффект некоторых препаратов (термопсиса и др.) связан также со стимулирующим воздействием на рвотный и дыхательный центры.

К средствам рефлекторного действия относятся также препараты с преобладающей рвотной активностью (апоморфин, ликорин), оказывающие в малых дозах отхаркивающее действие. Ряд препаратов рефлекторного действия частично оказывает резорбтивный эффект: содержащиеся в них эфирные масла и другие вещества выделяются через дыхательные пути и вызывают усиление секреции и разжижение мокроты.

Препараты резорбтивного действия (йодид натрия и калия, аммония хлорид, частично натрия гидрокарбонат и др.) оказывают эффект в основном при их выделении (после приема внутрь) слизистой оболочкой дыхательных путей, стимулируют бронхиальные железы и вызывают непосредственное разжижение мокроты; в определенной мере они стимулируют также моторную функцию мерцательного эпителия и бронхиол, увеличивают объем мокроты, разжижают слизь и способствует усилению дренажной функции бронхов, и как результат – выраженный противовоспалительный эффект.

Термопсиса трава, трава мышатника (*Herba Thermopsisidis*).

Содержит алкалоиды (главный из которых термопсин), сапонины, эфирное масло, дубильные вещества, аскорбиновую кислоту. Действие всех этих веществ на организм сложное, но в целом отхаркивающее, в больших дозах – рвотное.

Применение: хронический бронхит. Настой готовят из расчета 0,6–1,0 г на 180–200 мл воды.

По 1 ст. л. принимают 2–4 раза в день; сухой экстракт по 0,01 —0,05 г, таблетки от кашля – по 1 таблетке на прием. Детям – соответственно возрасту.

Форма выпуска: экстракт термопсиса сухой (*Extractum Thermopsisidis siccum*) в банках; таблетки от кашля (*Tabulettae contra tussim*), содержащие 0,01 г травы термопсиса в мелком порошке, натрия гидрокарбоната 0,25 № 10, сухая микстура от кашля для взрослых. Список Б.

50. Корень алтея, мукалтин, грудной эликсир, ликвиритон, глицирам

Содержит до 35 % растительной слизи.

Применяют в виде порошка, настоя, сиропа как отхаркивающее и противовоспалительное средство при заболеваниях дыхательных путей.

Входит в состав грудного сбора № 1, 3. 1 ст. л. сбора заливают стаканом кипятка, настаивают 20 мин, процеживают и принимают по 0,5 стакана 2–3 раза в день.

Форма выпуска: экстракт алтейного корня сухой в банке; сироп алтейный по 100,0 мл; сухая микстура от кашля для детей (*Mixtura sicca contra tussim pro in-fatibus*), в состав которой входят еще натрия бензоат и натрия гидрокарбонат, аммония хлорид, масло анисовое; грудные сборы № 1 (корень алтея, листья мать-и-мачехи, трава душицы) и № 3 (корень алтея, корень солодки, листья шалфея, плоды аниса и почки сосны).

Мукалтин (*Mucaltinum*).

Препарат, содержащий смесь полисахаридов и травы алтея лекарственного. Назначают по 1–2 таблетке на прием перед едой при острых и хронических заболеваниях дыхательных путей.

Грудной эликсир (*Elixir pectoralis*) – 25 мл. Состав: экстракт солодкового корня густой, масло анисовое, аммиак водный, спирт этиловый. Принимают как отхаркивающее по 20–40 капель 3–4 раза в день, детям – 1 капля на год жизни.

Ликвиритон (*Liquiritonum*).

Содержит сумму флавоноидов из корней и корневищ солодки.

Применение: как противовоспалительное, спазмолитическое и антисекреторное средство.

Принимают внутрь по 0,1–0,2 г 3–4 раза в день, курс лечения – 20–30 дней.

Форма выпуска: таблетки по 0,1 № 25. Глицирам (*Glycyrrhamum*).

Монозамещенная аммониевая соль глициризи-новой кислоты, выделенной из корней солодки, оказывает противовоспалительное действие, связанное с умеренно стимулирующим влиянием на кору надпочечников.

Применение: бронхиальная астма, аллергические дерматиты, экземы. Может применяться с целью уменьшения дозировки глюкокортикоидов. Назначают внутрь по 0,05–0,1 г 2–4 раза в день (до 3–6 раз), за 30 мин до еды. Курс лечения – от 2 до 6 недель. Нельзя принимать при органических заболеваниях сердца и нарушениях функции печени и почек.

Форма выпуска: таблетки по 0,05 № 50. Список Б.

К этой группе еще относятся корневище с корнями синюхи (*Rhizoma cum radicibus Polemonii*), корневище и корни девясила (*Rhizoma cum radicibus Inulae helenii*), листья подорожника большого (*Folium Plantaginis majoris*) и препарат из него плантаглюцид (*Plantaglucidum*), который принимают по 0,5–1,0 г 2–3 раза в день; листья мать-и-мачехи (*Folium Farfarae*), трава чабреца (*Herba Serpylli*) и препарат из него пертусин, который принимают от 1–2 ч. л. до 1 дес. л. (*Pertussinum*), плод аниса (*Fructus Anisi vulgaris*), трава багульника болотного (*Herba Ledi Palustris*), трава душицы (*Herba Origanii vulgaris*), почки сосновые (*Turiones Pini*), трава фиалки трехцветной (*Herba Violae tricolori*).

51. Классификация слабительных средств, листья сенны, рамнил, бисакодил

Современная классификация слабительных препаратов по механизму действия включает 4 группы средств.

Первая группа. Химические средства, вызывающие послабляющий эффект путем химического раздражения рецепторного аппарата толстой кишки и таким образом стимулирующие ее перистальтику. Эти препараты действуют на уровне толстой кишки, как правило, вызывают однократную дефекацию через 6—10 ч после приема. К ним относятся производные антрахинов (препараты корня ревеня, коры крушины, плодов жостера, листьев сенны), дифенилметана (фенолфталеин, бисакодил, гутталакс, дульколак), касторовое масло.

Вторая группа. Осмотические средства, обладающие способностью удерживать воду в просвете кишечника, что ведет к увеличению объема и размягчению каловых масс. Это – натрия и магния сульфат, цитрат, гидроокись магния, карловарская соль, не-адсорбируемый полисахарид лактулоза (дюфалак), действующие на уровне толстой кишки. Время наступления послабляющего действия – 8—12 ч. Лактулоза в тонком кишечнике не расщепляется и поступает в толстую кишку в неизмененном виде. В толстой кишке она расщепляется под действием кишечной флоры. Продукты расщепления лактулозы оказывают стимулирующее действие на перистальтику толстой кишки, каловые массы размягчаются, кроме того, увеличивается их объем.

Третья группа. Объемные слабительные, или наполнители, способствующие увеличению объема содержимого кишечника, такие как отруби, агар-агар, ме-тилцеллюлоза, морская капуста.

Четвертая группа. Слабительные масла (детергенты), способствующие размягчению твердых каловых масс и облегчающие их скольжение – вазелиновое, миндальное, фенхелевое масла, жидкий парафин. Классификация по локализации действия. Лекарственные средства, преимущественно действующие в тонком кишечнике (растительные масла, вазелиновое масло, солевые слабительные). Лекарственные средства, действующие преимущественно в толстой кишке (синтетические средства, бисакодил, гутталакс. Средства, действующие во всем кишечнике (солевые слабительные, касторовое масло и гидрофильные коллоиды). Листья сенны (*Folium Sennae*). Применение: в виде настоя по 1 ст. л. или по 1 ч. л. 1–3 раза в день.

Форма выпуска: цельные и резаные листья по 50 г., экстракт сухой в таблетках по 0,03 № 25., брикеты по 75 г. Готовые препараты: сеннаде № 10 в таблетках, глаксена № 10 в таблетках.

Рамнил (*Rhamnilum*). Сухой стандартизированный препарат коры крушины.

Применение: принимают как слабительное по 0,2 г на ночь.

Форма выпуска: таблетки по 0,05 № 30. Бисакодил (*Bisacodyl*).

Применение: хронические запоры различной этиологии.

Способ применения: назначают *per os* и *per rectum*. Взрослым по 1–3 драже на ночь или по 1–2 суппозитория ректально. Детям – в зависимости от возраста.

Побочные действия: возможны спазмы желудочно-кишечного тракта.

Противопоказания: острые воспалительные заболевания и варикозное расширение вен прямой кишки.

Форма выпуска: драже по 0,005 № 30, свечи по 0,01 № 12.

52. Классификация средств, действующих на сердечно-сосудистую систему

Средства, действующие на сердечно-сосудистую систему, можно разделить на несколько групп:

- 1) кардиотонические средства;
- 2) антиаритмические препараты;
- 3) средства, улучшающие кровоснабжение органов и тканей, мозговое кровообращение;
- 4) гипотензивные и гипертензивные средства;
- 5) ангиопротекторы и гиполипидемические средства;
- 6) средства, ингибирующие и стимулирующие свертывание крови.

Кардиотонические средства широко используются для лечения сердечной недостаточности. Наряду с препаратами, стимулирующими сократительную деятельность миокарда (сердечными гликозидами), используются средства, уменьшающие нагрузку на миокард и облегчающие работу сердца, снижающие энергетические затраты сердечной мышцы и улучшающие ее функцию более экономной деятельностью. Такими средствами комплексной терапии являются прежде всего периферические вазодилататоры, уменьшающие пре- и постнагрузку на миокард путем уменьшения периферического сосудистого сопротивления и расширения периферического сосудистого русла, а также диуретические средства, уменьшающие нагрузку на миокард, оказывая гиповолемическое действие, т. е. снижая объем циркулирующей плазмы крови. В определенной мере кардиотоническими свойствами обладают средства, оказывающие общее положительное влияние на метаболические процессы организма, включая метаболизм миокарда (анаболические гормоны, рибоксин и др.). В лечении острой сердечной недостаточности, кроме прессорных аминов, применяют современные адреномиметические препараты (дофамин, добут-рекс) и кардиотоники коротроп (малтринон).

Сердечные гликозиды.

К этой группе относятся лекарственные препараты, усиливающие сократимость миокарда. К растениям, содержащим сердечные гликозиды, относятся разные виды наперстянки (*Digitalis purpurea* L.) горюцвета (*Adonis vernalis* L.), ландыш (*Convallaria majalis* L.), разные виды желтушника (*Erysimum canescens* Roth.), строфанта (*Strophanthus gratus*, *Strophanthus Kombe*), олеандр (*Nerium oleander*), морозник (*Helleborus purpurascens* W. et K.) и др. Механизм действия сердечных гликозидов связан с активностью фермента аденозинтрифосфатазы, обеспечивающей транспорт ионов калия, натрия, кальция. Они нормализуют нарушенный в сердечной мышце энергетический и электролитный обмен, способствуют усвоению креатинфосфата, использование сердцем АТФ, увеличивают содержание гликогена в сердечной мышце. Терапевтический эффект сердечных гликозидов выражается в следующих изменениях работы сердца:

- 1) усиливается сила сердечных сокращений;
- 2) диастола становится более продолжительной;
- 3) замедление проводимости импульсов.

53. Классификация сердечных гликозидов.

Гликозиды длительного действия

Сердечные гликозиды подразделяют на три группы.

1. Гликозиды длительного действия, при введении которых максимальный эффект при приеме внутрь развивается через 8—12 ч и продолжается до 10 дней и более. При внутривенном введении действие наступает через 30–90 мин, максимальный эффект проявляется через 4–8 ч. К этой группе относятся гликозиды наперстянки пурпурной (дигитоксин и др.), обладающие выраженной кумуляцией.

2. Гликозиды средней продолжительности действия, при введении которых максимальный эффект проявляется через 5–6 ч и длится в течение 2–3 дней. При внутривенном введении наступает действие через 15–30 мин, максимальный – через 2–3 ч. К этой группе относятся гликозиды наперстянки шерстистой (дигоксин, целогид и др.), обладающие умеренной кумуляцией. Таким свойством обладают гликозиды наперстянки ржавой и горицвета.

3. Гликозиды быстрого и короткого действия – препараты экстренной помощи. Вводят только внутривенно, эффект наступает через 7—10 мин. Максимальное действие проявляется через 1–1,5 ч и длится до 12–24 ч. К этой группе относятся гликозиды строфанта и ландыша, практически не обладающие кумулятивными свойствами. Лечение сердечными гликозидами начинают с больших доз, назначаемых в течение 3–6 дней (фаза насыщения), до получения четкого терапевтического эффекта – уменьшения застойных явлений, устранения отеков, одышки, улучшения общего состояния. Затем дозу уменьшают и назначают поддерживающие дозы (фаза поддержания), обеспечивающие эффективную и безопасную терапию, с учетом индивидуальных особенностей больного. В случае передозировки сердечных гликозидов назначают препараты калия – панангин, аспаркам.

Гликозиды длительного действия. Дигитоксин (Digitoxin).

Гликозид, получаемый из различных видов наперстянки (*Digitalis purpurea* L., *Digitalis Lanata* Ehrh. и др.). Оказывает сильное кардиотоническое действие, увеличивает силу сокращения мышцы сердца, уменьшает частоту сердечных сокращений, обладает выраженными кумулятивными свойствами, быстро всасывается из желудочно-кишечного тракта.

Применение: хроническая сердечная недостаточность с нарушением кровообращения II и III стадии.

Способ применения: назначают внутрь по 0,1 мг и per rectum по 0,15 мг 1–2 раза в день. В. Р. Д. – 0,5 мг, В. С. Д. – 1 мг.

Побочное действие и противопоказания: те же, что и для других препаратов наперстянки. Форма выпуска: таблетки по 0,0001 г № 10, суппозитории ректальные по 0,00015 г № 10. Кордигит (Cordigitum).

Экстракт из сухих листьев наперстянки пурпуровой, содержащей комплекс гликозидов.

Побочные действия: при передозировке брадикардия – тошнота, экстрасистолия.

Противопоказания: острые эндокардиты, применяют осторожно при свежем инфаркте миокарда, нарушениях ритма.

Форма выпуска: таблетки по 0,8 мг № 10, суппозитории по 0,0012 № 10.

54. Гликозиды средней продолжительности действия

Лантозид (Lantosidum).

Применение: хроническая недостаточность I–III стадии, сопровождающихся тахикардией, тахиаритмией и мерцанием предсердий.

Способ применения: назначают внутрь по 15–20 капель 2–3 раза в день, при диспептических явлениях – микроклизмы, 20–30 капель, в 20 мл 0,9 %-ного раствора натрия хлорида. В. Р. Д. внутрь – 25 капель, В. С. Д. – 75 капель.

Форма выпуска: во флаконах-капельницах по 15 мл.

Целанид (Celanidum).

Синоним: изоланид. Гликозид, полученный из листьев наперстянки шерстистой (*Digitalis lanata* Ehev.). Действует на сердце подобно другим гликозидам наперстянки, дает быстрый эффект и мало кумулируется.

Применение: острая и хроническая недостаточность кровообращения, тахиаритмическая форма мерцания предсердий, пароксизмальная тахикардия.

Способ применения: принимают внутрь по 1 таблетке (0,25 мг) 2–3 раза в день; в/в по 1–2 мл 0,02 %-ного раствора 1–2 раза в сутки.

Побочное действие и противопоказания: те же, что и для других гликозидов наперстянки.

Форма выпуска: таблетки по 0,25 мг № 30, ампулы по 1 мл 0,02 %-ного раствора № 10, флаконы по 10 мл 0,05 %-ного раствора.

Дигоксин (Digoxinum).

Сердечный гликозид, содержащийся в листьях наперстянки шерстистой.

Применение, противопоказания: такие же, как у остальных препаратов этой группы.

Побочные действия: тошнота, рвота, потеря аппетита, тахикардия, бигеминия.

Форма выпуска: таблетки по 0,00025–0,0001 № 50, ампулы по 1 мл 0,025 %-ного раствора № 10. Список Б.

Мепросцилларин (Meproscillarum).

Сердечный гликозид из морского лука. Увеличивает силу и скорость сердечных сокращений, незначительно замедляет частоту сердечных сокращений (ЧСС), АВ-проводимость, при хронической сердечной недостаточности вызывает опосредованный вазоди-латирующий эффект, снижает венозное давление, повышает диурез, уменьшает одышку, отеки.

Применение: хроническая сердечная недостаточность, в том числе при наличии нормо- или бради-систолической мерцательной аритмии.

Способ применения: средняя разовая доза – 250 мкг 2–3 раза в сутки, при необходимости – до 1 мг в сутки.

Побочные действия: брадикардия, АВ-блокада, нарушение сердечного ритма, анорексия, тошнота, рвота, диарея, головная боль, усталость, головокружение. Реже бывают ксантопсия, снижение остроты зрения, скотомы, макро- и микропсия.

Противопоказания: абсолютные при повышенной чувствительности к препарату, относительные при выраженной брадикардии, изолированном митральном стенозе, остром инфаркте миокарда, нестабильной тахикардии, экстрасистолии, выраженных нарушениях функции печени, беременности, лактации.

Форма выпуска: таблетки по 250 мкг № 30.

55. Гликозиды короткого и быстрого действия. Нестероидные и синтетические кардиотоники

Гликозиды короткого и быстрого действия.

Строфантин К (Strophantinum K).

Оказывает систолическое действие, мало влияет на частоту сердечных сокращений и проводимость по пред-сердно-желудочковому пучку.

Применение: острая сердечно-сосудистая недостаточность, пароксизмальная тахикардия. Вводят в/в по 0,5–1 мл 0,025 %-ного или 0,05 %-ного раствора в 10–20 мл 40 %-ного раствора глюкозы. В. Р. Д. – 1 мл 0,05 %-ного раствора, В. С. Д. – 2 мл 0,05 %-ного раствора.

Побочные действия: как у мепросцилларина.

Противопоказания: органические поражения сердца и сосудов, острый миокардит, эндокардит, выраженный кардиосклероз.

Форма выпуска: ампулы по 1 мл 0,025 %-ного и 0,05 %-ного раствора № 10. Список Б. Коргликон (Corgliconum).

Очищенный препарат из листьев ландыша майского. Аналогичен конваллятоксину и строфантину, но дает более продолжительный эффект.

Применение: хроническая и острая недостаточность, пароксизмальная тахикардия. Вводят медленно по 0,5–1 мл 0,05 %-ного раствора в 20 мл 40 %-ного раствора глюкозы. В. Р. Д. – в/в 1 мл, В. С. Д. – 2 мл.

Побочные действия: те же, что и у строфантина.

Форма выпуска: ампулы по 1 мл 0,06 %-ного раствора № 10. Список Б.

Нестероидные и синтетические кардиотоники.

Коротроп (Korotrop).

Активное вещество – милринон лактат.

Применение: острая и хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации. Начинают с медленного внутривенного введения ударной дозы 50 мкг/кг массы тела, затем переходят на поддерживающую – 0,375–0,75 мкг/кг в 1 мин. Максимальная суточная доза – 1,13 мкг/кг массы тела.

Побочные действия: нарушение ритма сердца, стенокардия, гипотония, головная боль, аллергические реакции.

Форма выпуска: раствор для инъекций по 10 мл в ампулах № 10 (в 1 мл 1 г коротропа). Эскандин (Escandin).

Активное вещество – ибопамина гидрохлорид. Оказывает положительное инотропное действие, вызывает увеличение ударного и минутного объемов сердца, улучшает перфузию почек, увеличивает диурез, уменьшает нагрузку на миокард, снижает продукцию норадреналина, ренина и альдостерона, в терапевтических дозах не влияет на АД и ЧСС.

Применение: хроническая сердечная недостаточность. Дозу устанавливают индивидуально. Разовая доза – 50–200 мг, кратность приема 2–3 раза в сутки за 1 ч до еды.

Побочные действия: со стороны ЖКТ иногда тошнота, изжога, гастралгии, возможна тахикардия.

Противопоказания: желудочковые аритмии, феохромоцитома, беременность, лактация.

Форма выпуска: таблетки по 50 и 100 мг № 30.

56. Классификация антиаритмических препаратов

Антиаритмические препараты – лекарственные средства, оказывающие нормализующее влияние на нарушенный ритм сердечных сокращений, относятся к разным классам химических соединений и принадлежат к разным фармакологическим группам. Но существует ряд препаратов, для которых основное действие – это нормализующее влияние на ритм сердца при различных видах аритмии. Подразделяются препараты на четыре группы (класса):

- 1) мембраностабилизирующие средства (хинидинопо-добные) – I класс;
- 2) β -адреноблокаторы – II класс;
- 3) препараты, замедляющие реполяризацию (основной представитель амиодарон, симпатолитик орнид) – III класс;
- 4) блокаторы кальциевых каналов (антагонисты ионов кальция) – IV класс.

I класс включает ряд препаратов, разделяющихся по некоторым особенностям действия. Условно их подразделяют на три подгруппы:

- 1) подгруппа IA – хинидин, новокаинамид, этмозин, дизопирамид;
- 2) подгруппа IS – местные анестетики (лидокаин, три-мекаин, пиромекаин), а также мексилетин и дифенин;
- 3) подгруппа IC – аймалин, этагизин, аллапинин.

Антиаритмические препараты I группы.

Хинидина сульфат (Chinidini sulfas).

Применение: пароксизмальная тахикардия, пароксизм мерцательной аритмии, экстрасистолы, стойкая мерцательная аритмия. Внутрь принимают по 0,1 4–5 раз в день, при необходимости – до 0,8–1,6 г в сутки.

Побочные действия: при передозировке – угнетение сердечной деятельности, тошнота, рвота, понос, иногда фибрилляция предсердий.

Противопоказания: декомпенсация сердечнососудистой системы, беременность.

Форма выпуска: порошок, таблетки по 0,1 № 20.

Новокаинамид (Novocainamidum).

Понижает возбудимость мышц сердца, подавляет эктопические очаги возбуждения, обладает местно-анестезирующим свойством.

Применение: нарушения сердечного ритма.

Способ применения: внутрь назначают по 0,5–1 г 3–4 раза в сутки; в/м – 5–10 мл 10 %-ного раствора, в/в (капельно) для купирования острых приступов – 2–10 мл 10 %-ного раствора в 5 %-ном растворе глюкозы или 0,9 %-ном растворе натрия хлорида.

Побочные действия: коллатеральные реакции, общая слабость, головная боль, тошнота, бессонница.

Противопоказания: выраженная сердечная недостаточность, нарушение проводимости.

Форма выпуска: таблетки по 0,25 г № 20, ампулы по 5 мл 10 %-ного раствора № 10.